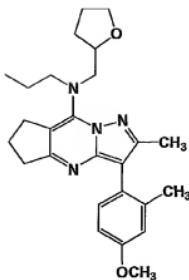


TLC : Rf 0.79 (ヘキサン : �酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.57 (brd, J = 8.1Hz, 2H), 7.44 (brd, J = 8.1Hz, 2H),  
 7.18 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 4.91 (s,  
 5 2H), 3.83 (s, 3H), 3.49 - 3.25 (m, 2H), 2.90 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.87 (t, J = 7.8Hz, 2H),  
 2.35 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.18 - 2.00 (m, 2H), 1.62 - 1.50 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.5Hz,  
 3H)。

### 実施例2 (125)

- 10 8-(N-ブロピル-N-(テトラヒドロフラン-2-イル)メチルアミノ)  
 -2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

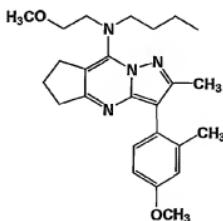


TLC : Rf 0.31 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 3.84 - 4.06 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.64 - 3.80 (m, 3H), 3.50 - 5 3.64 (m, 2H), 2.99 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 8.1Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.74 - 2.00 (m, 3H), 1.42 - 1.65 (m, 3H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 3H).

### 実施例2 (126)

8 - (N-ブチル-N- (2-メトキシエチル) アミノ) - 2-メチル-3  
10 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロ  
コペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



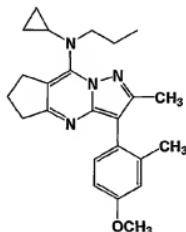
TLC : Rf 0.30 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 3.92 (t, J = 5.7Hz, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.57 (m, 2H), 3.50 (t, J = 5.7Hz, 2H), 3.28 (s, 3H), 2.98 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.55 (m, 2H), 1.33 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

5

実施例2 (127)

8-(N-プロピル-N-シクロプロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



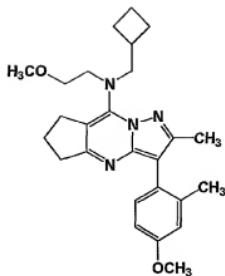
10

TLC : Rf 0.45 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 3.85 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.19 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.07 (m, 1H), 2.92 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.12 (m, 2H), 1.62 (m, 2H), 15 0.89 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.80 - 0.68 (m, 4H)。

実施例2 (128)

8-(N-シクロプロピルメチル-N-(2-メトキシエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン  
20



TLC : R<sub>f</sub> 0.57 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

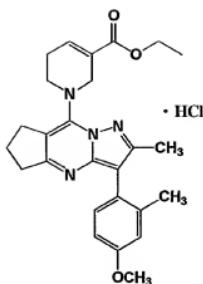
NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.17 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78

(dd,  $J = 2.7, 8.4\text{Hz}$ , 1H), 3.82 (s, 3H), 3.82 (t,  $J = 6.0\text{Hz}$ , 2H), 3.64 (d,  $J = 7.5\text{Hz}$ , 2H),

5 3.49 ( $t$ ,  $J = 6.0\text{Hz}$ , 2H), 3.28 (s, 3H), 2.96 ( $t$ ,  $J = 7.2\text{Hz}$ , 2H), 2.91 ( $t$ ,  $J = 7.8\text{Hz}$ , 2H),  
 2.62 - 2.50 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.20 - 2.05 (m, 2H), 2.06 - 1.58 (m,  
 6H).

## 実施例2（129）

10 8-(3-エトキシカルボニル-1, 2, 5, 6-テトラヒドロピリジル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

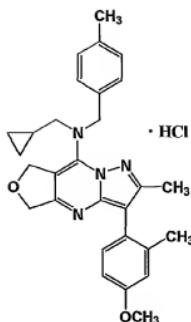


TLC : Rf 0.27 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.27 (m, 1H), 7.09 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 4.62 (m, 2H), 4.27 (q, J = 6.9Hz, 2H), 4.20 (t, J = 5.7Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.47 (t, J = 7.2Hz, 2H), 3.16 (t, J = 6.0Hz, 2H), 2.85 (m, 2H), 2.27 (s, 3H), 2.26 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 1.34 (t, J = 6.9 Hz, 3H).

### 実施例2 (130)

8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ) - 2-メチル - 3-(2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロ - フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩  
10

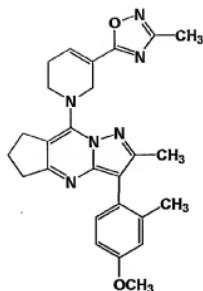


TLC : Rf 0.68 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.21 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.16 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.41 (brs, 2H), 5.27 (m, 2H), 5.22 (brs, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.74 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.24 (m, 1H), 0.67 (m, 2H), 0.24 (m, 2H).

### 実施例2 (131)

8-(3-(3-メチル-1,2,4-オキサジアゾール-5-イル)-1,2,6-テトラヒドロピリジル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

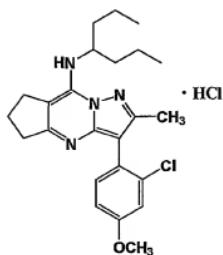


TLC : R f 0.18 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.29 (m, 1H), 7.15 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 4.57 (m, 2H), 3.94 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 5 3.09 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.71 (m, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.14 (m, 2H).

### 実施例2 (132)

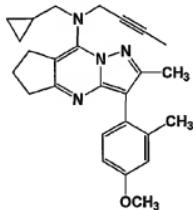
8-(4-ヘプチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.48 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.37 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.97  
 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 4.13 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.35 - 3.66 (m, 2H), 3.13 (t, J =  
 7.5Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.29 (m, 2H), 1.60 - 1.84 (m, 4H), 1.34 - 1.60 (m, 4H),  
 5 1.00 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.99 (t, J = 7.5Hz, 3H).

実施例 2 (133)

8-(N-シクロプロピルメチル-N-(2-ブチリル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5  
 10 H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

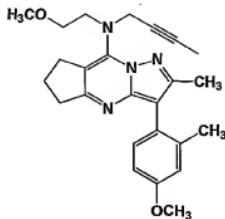


TLC : Rf 0.73 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78  
 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 4.54 (brs, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.53 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.13 (t,  
 15 J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.17 - 2.08 (m,  
 2H), 1.81 (t, J = 2.7Hz, 3H), 1.20 - 1.16 (m, 1H), 0.60 - 0.52 (m, 2H), 0.36 - 0.28 (m,  
 2H)。

実施例 2 (134)

20 8-(N-(2-メトキシエチル)-N-(2-ブチリル)アミノ)-2-

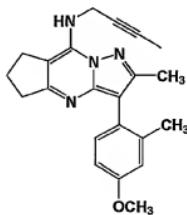
メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-  
5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



- TLC : Rf 0.13 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;
- 5 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.44 - 4.39 (m, 2H), 3.92 (t, J = 6.0Hz, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.65 (t, J = 6.0Hz, 2H), 3.34 (s, 3H), 3.13 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.17 - 2.08 (m, 2H), 1.81 (t, J = 2.7Hz, 3H).

10 実施例2(135)

8-(2-ブチリルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



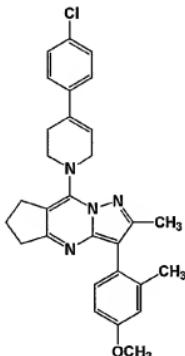
- 15 TLC : Rf 0.80 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 6.53 (t, J = 6.9Hz, 1H), 4.36 - 4.30 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.25 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.20 - 2.08 (m, 2H), 1.83 (t, J = 2.1Hz, 3H).

5

実施例2 (136)

8-(4-(4-クロロフェニル)-1,2,5,6-テトラヒドロピリジル)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



10

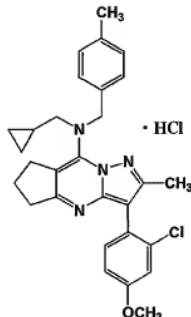
TLC : Rf 0.10 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.42 - 7.30 (m, 4H), 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 6.22 - 6.18 (m, 1H), 4.50 - 4.32 (m, 2H), 4.10 - 3.90 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.10 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.5Hz, 2H),

15 2.82 - 2.69 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 2.17 - 2.08 (m, 2H).

実施例2 (137)

8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



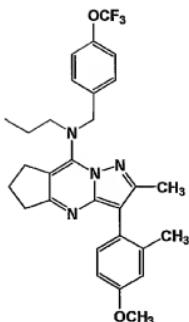
5

TLC : Rf 0.53 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.36 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.18 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.15 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.25 (d, J = 15.9Hz, 1H), 5.21 (d, J = 15.9Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.70 (m, 2H), 3.36 - 3.62 (m, 2H), 3.07 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.23 (m, 2H), 1.23 (m, 1H), 0.63 (m, 2H), 0.18 (m, 2H).

### 実施例2(138)

8-(N-プロピル-N-(4-トリフルオロメチルオキシフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

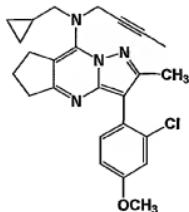


TLC : Rf 0.55 (ヘキサン : �酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 (brd, J = 8.7Hz, 2H), 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.15 (brd, J = 8.7Hz, 2H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.84 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.41 - 3.35 (m, 2H), 2.89 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.83 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.19 - 2.00 (m, 2H), 1.66 - 1.54 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.5Hz, 3H).

#### 実施例2 (139)

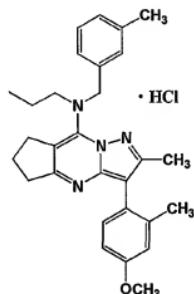
- 10 8-(N-(2-ブチリル)-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



TLC : Rf 0.40 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.88  
 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 4.54 (q, J = 2.1Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.52 (s, 3H), 2.13 (quint, J =  
 5.1Hz, 2H), 3.13 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.37 (s, 3H), 0.60 - 0.52 (m, 2H), 0.32 -  
 0.26 (m, 2H).

### 実施例2 (140)

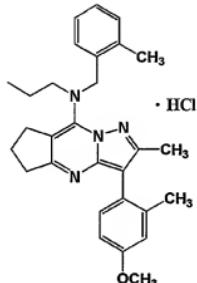
8-(N-プロピル-N-(3-メチルフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.52 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.27 (m, 1H), 7.15 (m, 1H), 7.13 (d, J = 8.1Hz, 1H),  
 7.05 (m, 2H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 5.14 (s, 2H),  
 3.83 (s, 3H), 3.74 (m, 2H), 3.49 (t, J = 7.2Hz, 2H), 3.02 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.36 (s,  
 3H), 2.29 (s, 3H), 2.22 (m, 2H), 2.20 (s, 3H), 1.77 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2Hz, 3H).

実施例 2 (141)

8 - (N-プロピル-N-(2-メチルフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

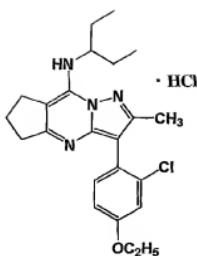


5

TLC : R<sub>f</sub> 0.52 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.18 - 7.30 (m, 4H), 7.13 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.4, 8.1Hz, 1H), 5.13 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.78 (m, 2H), 3.49 (t, J = 6.9Hz, 2H), 3.00 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.21 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.79 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2Hz, 3H).

実施例 2 (142)

8 - (3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-エトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

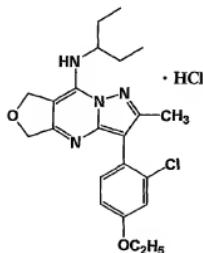


TLC : Rf 0.49 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 4.07 (m, 2H), 3.99 (m, 1H), 3.34 - 3.65 (m, 2H), 3.13 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.29 (m, 2H), 1.62 - 1.93 (m, 4H), 1.42 (t, J = 6.9Hz, 3H), 1.06 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.05 (t, J = 7.2Hz, 3H).

### 実施例2 (143)

8-(3-ベンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-エトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフローフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



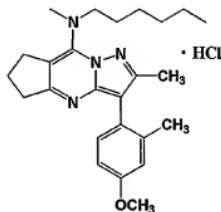
TLC : Rf 0.40 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.52 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 5.49 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.39 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.28 (brs, 2H), 4.07 (m, 2H), 3.40 (m, 1H), 2.40 (s, 3H), 1.68 - 1.98 (m, 4H), 1.43 (t, J = 6.9Hz, 3H), 1.07 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.06 (t, J = 7.2Hz, 3H).

5

#### 実施例2 (144)

8-(N-メチル-N-ヘキシリアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



10

TLC : Rf 0.09 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

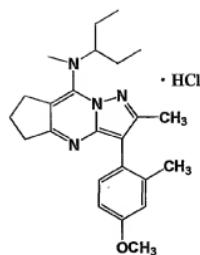
NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.01 - 3.95 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.51 (s, 3H), 3.51 - 3.42 (m, 2H), 3.18 - 3.06 (m, 2H), 2.26 (s, 3H), 2.26 - 2.18 (m, 2H), 2.18 (s, 3H), 1.96 - 1.80 (m, 2H), 1.44 - 1.25 (m, 6H), 0.90 (brt, J = 6.6Hz, 3H).

15

#### 実施例2 (145)

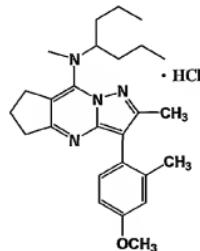
8-(N-メチル-N-(3-ベンチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

20



TLC : R<sub>f</sub> 0.47 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82  
 (m, 1H), 4.55 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.46 (t, J = 7.8Hz, 2H), 3.27 (s, 3H), 3.10 (t, J =  
 5.6Hz, 2H), 2.26 (s, 3H), 2.45 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.76 - 1.98 (m, 4H), 1.01 (t, J =  
 7.2Hz, 6H).

実施例2 (146)  
 8-(N-メチル-N-(4-ヘプチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-  
 10 メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペン  
 タ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



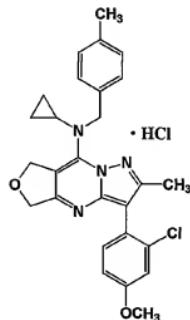
TLC : R<sub>f</sub> 0.51 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 3.0, 8.4Hz, 1H), 4.80 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.47 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.27 (s, 3H), 3.09 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.64 - 1.94 (m, 4H), 1.28 - 1.58 (m, 4H), 0.97 (t, J = 7.2Hz, 6H).

5

実施例2 (147)

8-(N-シクロプロピル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



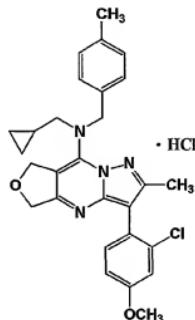
10

TLC : Rf 0.54 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.34 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.11 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.09 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.02 (d, J = 7.8Hz, 2H), 6.94 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 5.18 - 5.30 (m, 4H), 5.15 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 2.67 (m, 1H), 2.41 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 0.85 - 1.00 (m, 4H).

実施例2 (148)

8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



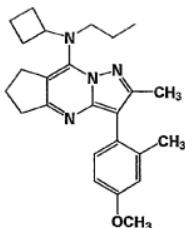
5 T L C : R<sub>f</sub> 0.58 (ヘキサン:酢酸エチル=1:1) ;

N M R (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.35 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.19 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.17 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.10 - 5.50 (m, 6H), 3.85 (s, 3H), 3.69 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.21 (m, 1H), 0.65 (m, 2H), 0.22 (m, 2H).

10

### 実施例2(149)

8-(N-シクロブチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

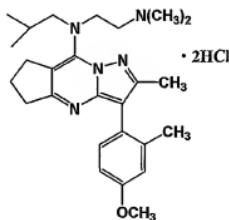


TLC : R<sub>f</sub> 0.45 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.17 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 4.35 (quint, J = 7.5Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.69 - 3.10 (m, 5H), 2.94 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.22 - 2.02 (m, 9H), 1.78 - 1.58 (m, 2H), 1.39 (sext, J = 7.8Hz, 2H), 0.84 (t, J = 7.8Hz, 3H).

### 実施例2 (150)

8-(N-イソブチル-N-(2-ジメチルアミノエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロヘンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・2塩酸塩  
10



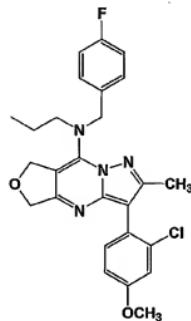
TLC : R<sub>f</sub> 0.63 (酢酸エチル : 酢酸 : 水 = 3 : 1 : 1) ;

NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) : δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.91 (d, J = 2.7Hz, 1H), 15 6.82 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.08 - 3.98 (m, 2H), 3.78 (s, 3H), 3.50 - 3.42 (m, 2H),

3.42 - 3.32 (m, 2H), 3.01 (brt, J = 6.9Hz, 2H), 2.87 (brt, J = 7.8Hz, 2H), 2.79 (s, 3H), 2.77 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.18 - 2.00 (m, 2H), 2.08 (s, 3H), 1.80 - 1.64 (m, 1H), 0.83 (d, J = 6.6Hz, 6H)。

### 5 実施例2 (151)

8-(N-プロピル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-プロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



10 TLC : Rf 0.34 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1) ;

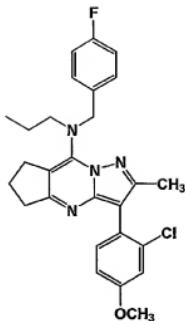
NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.31 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.28 - 7.24 (m, 2H), 7.08 (d, J = 3.0Hz, 1H), 7.05 - 6.97 (m, 2H), 6.90 (dd, J = 8.7, 3.0Hz, 1H), 5.09 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.33 - 3.27 (m, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.63 (sext, J = 7.8Hz, 2H), 0.39 (t, J = 7.8Hz, 3H)。

15

### 実施例2 (152)

8-(N-プロピル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-

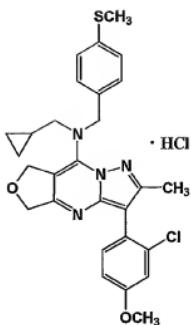
## 5 H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



TLC : R f 0.36 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.28 - 7.20 (m, 2H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.02 - 6.94 (m, 2H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.36 (brt, J = 7.5Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.82 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.07 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.68 - 1.48 (m, 2H), 0.87 (t, J = 7.5Hz, 3H).

実施例2 (153)

10 8- (N-シクロプロピルメチル-N- (4-メチルチオフェニル) メチルアミノ) -2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドローフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

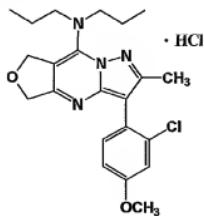


TLC : Rf 0.67 (ヘキサン : �酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.35 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.27 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.22 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.09 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.48 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.37 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.33 (d, J = 15.9Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 5.24 (d, J = 15.9Hz, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.69 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.19 (m, 1H), 0.69 (m, 2H), 0.24 (m, 2H).

#### 実施例2 (154)

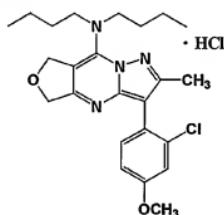
10 8-(N,N-ジブロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-1-フロ [3,4-d]ビラゾロ [1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.69 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.33 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.96  
 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 5.48 (td, J = 1.8, 16.8Hz, 1H), 5.36 (td, J = 1.8, 16.8Hz, 1H),  
 5.21 (t, J = 1.8Hz, 2H), 3.85 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.83 (m, 4H), 1.02 (t,  
 5 H = 7.2Hz, 6H).

実施例2 (155)

8-(N,N-ジブチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-7-プロピオニル-2H-1,2,4-トリazole [3, 4-d] ピラゾロ [1, 10 5-a] ピリミジン・塩酸塩

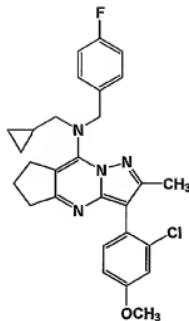


TLC : Rf 0.74 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.34 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.96  
 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 5.47 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.36 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.21 (s,  
 15 2H), 3.88 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 1.79 (m, 4H), 1.42 (m, 4H), 1.00 (t, J =  
 7.2Hz, 6H).

実施例2 (156)

8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7

7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン

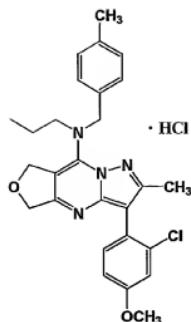


TLC : Rf 0.27 (ヘキサン:酢酸エチル=1:1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.33 - 7.26 (m, 3H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.01 - 5 6.95 (m, 2H), 6.88 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.88 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.38 (d, J = 6.9Hz, 2H), 2.96 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.10 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.10 - 0.98 (m, 1H), 0.49 - 0.42 (m, 2H), 0.08 - 0.02 (m, 2H).

### 実施例2 (15.7)

- 10 8-(N-プロピル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-5H-ビラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

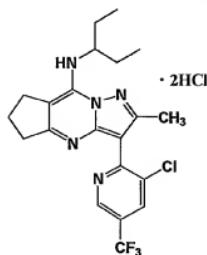


TLC : R<sub>f</sub> 0.43 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.33 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.19 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 5.28 (m, 2H), 5.13 (m, 2H), 5.08 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.64 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.80 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.5Hz, 3H).

### 実施例2 (15-8)

8-(3-ベンチルアミノ)-2-メチル-3-(3-クロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-イル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・2塩酸塩  
10



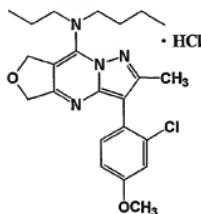
TLC : Rf 0.19 (ヘキサン : �酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.91 (s, 1H), 8.12 (s, 1H), 3.99 (m, 1H), 3.50 (m, 2H), 3.15 (m, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.32 (m, 2H), 1.94 - 1.64 (m, 4H), 1.06 (brt, J = 6.9Hz, 6H);

5

#### 実施例2 (159)

8-(N-ブチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



10

TLC : Rf 0.21 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.34 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 5.47 and 5.35 (ABd, J = 16.5Hz, 2H), 5.21 (brs, 2H), 4.00 - 3.75 (m) and 3.85 (s) total 7H, 2.34 (s, 3H), 1.90 - 1.75 (m, 4H), 1.42 (sext, J = 7.2Hz, 2H), 1.05 - 0.98 (m, 6H).

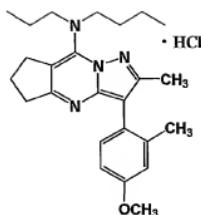
15

#### 実施例2 (160)

8-(N-ブチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]

20

ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

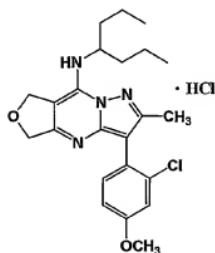


TLC : Rf 0.33 (ヘキサン : �酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.12 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 3.95 - 3.80 (m) and 3.83 (s) total 7H, 3.48 (t, J = 7.5Hz, 2H), 5.02 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.30 - 2.18 (m) and 2.27 (s) total 5H, 2.19 (s, 3H), 1.80 - 1.65 (m, 4H), 1.38 (sext, J = 7.2Hz, 2H), 0.96 (t, J = 7.2Hz, 6H).

### 実施例 2 (161)

8-(4-ヘプチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7ジヒドロ-1H-1,2,4-オキサ-6-ゼンゾラム [3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



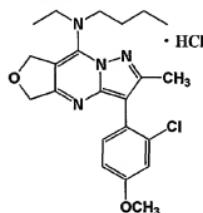
TLC : Rf 0.54 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.52 (d, J = 10.2Hz, 1H), 7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08

(d, J = 2.4Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 5.49 (brd, J = 16.8Hz, 1H), 5.39 (d, J = 16.8Hz, 1H), 5.28 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.53 (m, 1H), 2.39 (s, 3H), 1.75 (m, 4H), 1.47 (m, 4H), 1.00 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

### 5 実施例 2 (162)

8-(N-ブチル-N-エチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ[1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



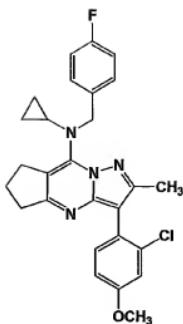
10 TLC : Rf 0.48 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.33 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 5.46 (m, 1H), 5.35 (m, 1H), 5.23 (t, J = 1.5Hz, 2H), 3.80 - 4.00 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 1.80 (m, 2H), 1.46 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.44 (m, 2H), 1.01 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

15

### 実施例 2 (163)

8-(N-シクロプロピル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン

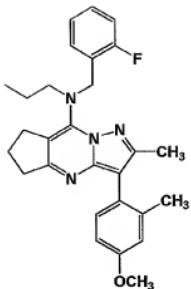


TLC : Rf 0.80 (ヘキサン : �酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.17 - 7.09 (m, 2H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 - 6.93 (m, 2H), 6.90 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.01 (s, 2H), 3.84 (s, 5H), 2.97 - 2.86 (m, 4H), 2.75 (m, 1H), 2.39 (s, 3H), 2.03 (m, 2H), 0.80 - 0.68 (m, 4H).

#### 実施例2 (164)

8-(N-プロピル-N-(2-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

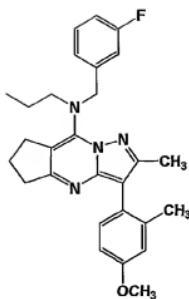


TLC : Rf 0.85 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.24 - 7.12 (m, 2H), 7.19 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.06 - 6.97 (m, 2H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.00 - 4.92 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.42 - 3.36 (m, 2H), 2.86 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.75 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.02 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.68 - 1.46 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3H).

### 実施例2 (165)

- 10 8-(N-プロピル-N-(3-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

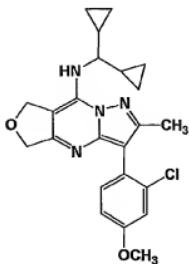


TLC : R<sub>f</sub> 0.86 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.30 - 7.22 (m, 1H), 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 - 7.01 (m, 2H), 6.98 - 6.90 (m, 1H), 6.87 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.85 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.42 - 3.36 (m, 2H), 2.89 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.86 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.09 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.68 - 1.52 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.5Hz, 3H).

### 実施例2 (166)

- 10 8-ジシクロプロピルメチルアミノ-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



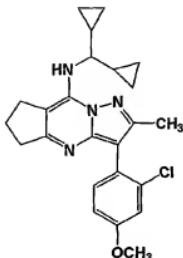
TLC : Rf 0.39 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 6.48 (brd, J = 9.9Hz, 1H), 5.22 (brs, 2H), 4.89 (brs, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.87 (m, 1H), 2.37 (s, 3H), 1.15 (m, 2H), 0.61 (m, 4H), 0.42 (m, 4H).

5

実施例2 (167)

8-ジシクロプロピルメチルアミノ-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



10

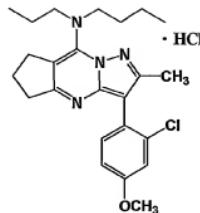
TLC : Rf 0.40 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.29 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.87 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 6.37 (brd, J = 9.9Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.40 (m, 1H), 3.01 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.11 (m, 2H), 1.14 (m, 2H), 15 0.50 - 0.66 (m, 4H), 0.35 - 0.50 (m, 4H).

実施例2 (168)

8-(N-ブチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]

## ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

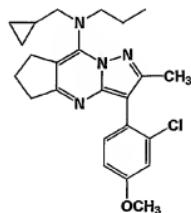


TLC : Rf 0.52 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.40 - 7.30 (m, 1H), 7.08 (s, 1H), 7.00 - 6.90 (m, 1H),  
 5 4.00 - 3.80 (m) and 3.85 (s) total 7H, 3.65 - 3.30 (m, 2H), 3.10 - 2.95 (m, 2H), 2.40 -  
 2.20 (m) and 2.33 (s) total 5H, 1.80 - 1.65 (m, 4H), 1.43 - 1.30 (m, 2H), 0.97 (t, J =  
 6.6Hz, 6H).

実施例2 (169)

- 10 8-(N-シクロプロピルメチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3  
 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シク  
 ロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



TLC : Rf 0.54 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

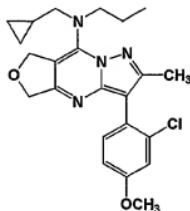
15 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.31 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.88

(dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.64 - 3.58 (m, 2H), 3.53 (d, J = 6.9Hz, 2H), 3.01 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.14 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.65 - 1.55 (m, 2H), 1.05 - 0.90 (m, 1H), 0.91 (t, J = 7.5Hz, 3H), 0.50 - 0.40 (m, 2H), 0.15 - 0.05 (m, 2H)。

5

実施例2 (170)

8 - (N-シクロプロピルメチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-  
- (2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-フロ [3,  
4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



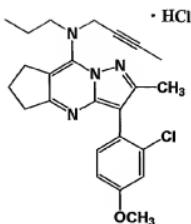
10

TLC : Rf 0.42 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.30 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89  
(dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.23 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.65 - 3.50 (m, 4H),  
2.38 (s, 3H), 1.63 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.10 - 0.98 (m, 1H), 0.94 (t, J = 7.2Hz, 3H),  
15 0.56 - 0.46 (m, 2H), 0.15 (dd, J = 10.8, 5.1Hz, 2H).

実施例2 (171)

8 - (N-(2-ブチニル)-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-  
- (2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペン  
20 タ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

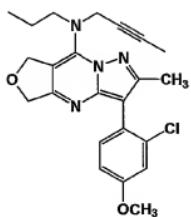


TLC : R<sub>f</sub> 0.44 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 1.8Hz, 1H), 6.96 (brd, J = 8.7Hz, 1H), 4.56 (d, J = 2.1Hz, 2H), 4.05 - 3.80 (m) and 3.85 (s) total 5H, 5 3.65 - 3.30 (m, 2H), 3.25 - 3.10 (m, 2H), 2.40 - 2.20 (m) and 2.33 (s) total 5H, 1.95 - 1.80 (m) and 1.89 (s) total 5H, 1.01 (t, J = 7.2Hz, 3H).

### 実施例2 (172)

8-(N-(2-ブチニル)-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



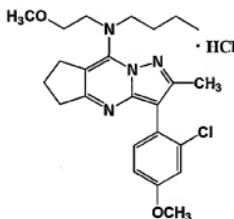
TLC : R<sub>f</sub> 0.36 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.28 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.32 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.45 (q, J = 2.1Hz, 2H), 3.84 (s,

3H), 3.55 - 3.45 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.82 (t, J = 2.1Hz, 3H), 1.72 (sext, J = 7.2Hz, 2H), 0.98 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

#### 実施例2 (173)

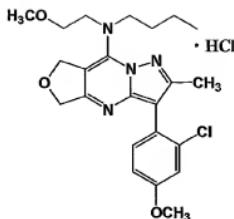
- 5 8-(N-ブチル-N-(2-メトキシエチル)アミノ)-2-メチル-3-  
- (2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6-, 7-ジヒドロ-5H-シク  
ロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩



- TLC : Rf 0.34 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;  
10 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.35 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.97  
(brd, J = 7.8Hz, 1H), 4.30 - 4.18 (m, 2H), 3.90 - 3.78 (m) and 3.85 (s) total 5H, 3.70 -  
3.30 (m) and 3.64 (m) total 4H, 3.30 (s, 3H), 3.08 - 2.98 (m, 2H), 2.40 - 2.18 (m) and  
2.33 (s) total 5H, 1.80 - 1.65 (m, 2H), 1.43 - 1.35 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.2Hz, 3H).

#### 実施例2 (174)

- 8-(N-ブチル-N-(2-メトキシエチル)アミノ)-2-メチル-3-  
- (2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5-, 7-ジヒドロ-プロ[3,  
4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

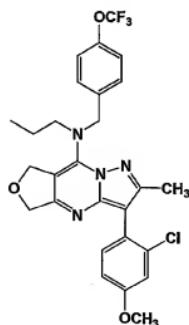


TLC : R<sub>f</sub> 0.39 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.40 - 7.30 (m, 1H), 7.08 (brs, 1H), 7.05 - 6.95 (m, 1H), 5.60 - 5.35 (m, 2H), 5.30 - 5.15 (m, 2H), 4.40 - 4.20 (m, 2H), 3.90 - 3.70 (m) and 3.85 (s) total 7H, 3.35 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 1.85 - 1.70 (m, 2H), 1.50 - 1.38 (m, 2H), 0.99 (t, J = 6.9Hz, 3H).

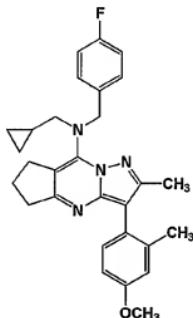
### 実施例2 (175)

8-(N-プロピル-N-(4-トリフルオロメチルオキシフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフローフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



TLC : Rf 0.42 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.39 - 7.33 (m, 2H), 7.31 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.21 - 7.15 (m, 2H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.12 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.36 - 3.28 (m, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.70 - 1.54 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 3H),

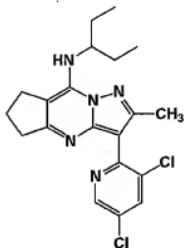
実施例2 (176)  
 8 - (N-シクロプロピルメチル-N- (4-フルオロフェニル) メチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 6, 7  
 10 10 -ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



TLC : Rf 0.28 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.33 - 7.26 (m, 2H), 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.03 - 6.94 (m, 2H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.88 (s, 2H),  
 15 3.83 (s, 3H), 3.38 (d, J = 6.9Hz, 2H), 2.95 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.89 (t, J = 6.9Hz, 2H),  
 2.36 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 2.09 (quint, J = 6.9Hz, 2H), 1.01 (m, 1H), 0.58 - 0.42 (m, 2H), 0.20 - 0.01 (m, 2H),

実施例2 (177)

8-(3-ベンチルアミノ)-2-メチル-3-(3,5-ジクロロピリジン-2-イル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



5

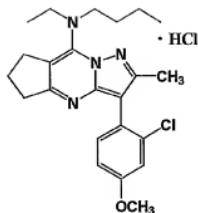
TLC : R<sub>f</sub> 0.38 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.58 (d, J=2.1Hz, 1H), 7.81 (d, J=2.1Hz, 1H), 6.24 (brd, J=11.1Hz, 1H), 3.80 (m, 1H), 3.08 (t, J=7.5Hz, 2H), 2.93 (t, J=7.5Hz, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.15 (quint, J=7.5Hz, 2H), 1.80 - 1.52 (m, 4H), 1.00 (t, J=7.5Hz, 6H).

10

実施例2 (178)

8-(N-ブチル-N-エチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

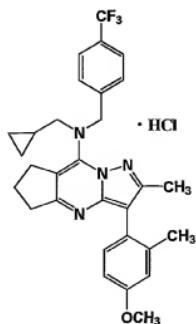


TLC : Rf 0.61 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.35 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 3.94 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 3.30 - 3.62 (m, 2H), 3.05 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.25 (m, 2H), 1.74 (m, 2H), 1.32 - 1.48 (m, 5H), 0.98 (t, J = 7.8Hz, 3H)。

### 実施例2 (179)

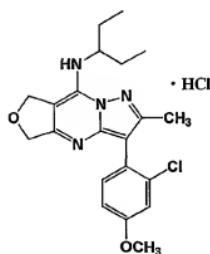
8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)  
10 メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)  
-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピ  
リミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.54 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.65 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.47 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.13  
 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 5.37 (s,  
 2H), 3.83 (s, 3H), 3.66 (m, 2H), 3.52 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.11 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.29  
 5 (s, 3H), 2.27 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.14 (m, 1H), 0.65 (m, 2H), 0.17 (m, 2H)

実施例 2 (180)

8-(3-ベンズルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-10a]ピリミジン・塩酸塩

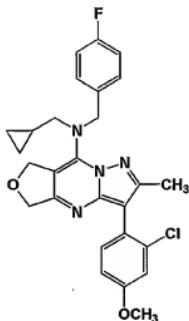


TLC : Rf 0.40 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.52 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 7.35 (d, J = 8.7Hz, 1H),  
 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 5.50 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.39  
 15 (d, J = 16.5Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.39 (m, 1H), 2.40 (s, 3H), 1.68 - 1.98  
 (m, 4H), 1.06 (m, 6H).

実施例 2 (181)

8-(N-シクロプロピルメチルアミノ-N-(4-フルオロフェニル)メ

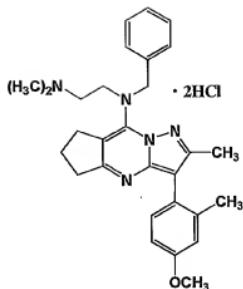
チルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5, 7 - ジヒドロ - プロ [3, 4 - d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン



- TLC : R<sub>f</sub> 0.28 (ヘキサン : �酢酸エチル = 3 : 1) ;
- 5 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.34 - 7.28 (m, 2H), 7.30 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.05 - 6.98 (m, 2H), 6.901 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.21 (s, 2H), 4.93 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.38 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 2.40 (s, 3 H), 1.08 - 0.94 (m, 1H), 0.56 - 0.48 (m, 2H), 0.14 - 0.06 (m, 2H).

#### 10 実施例 2 (182)

8 - (N - ベンジル - N - (2 - ジメチルアミノエチル) アミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン・2 塩酸塩

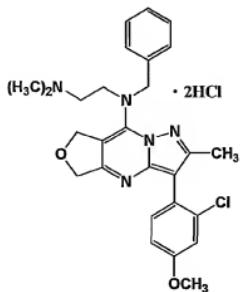


TLC : R f 0.60 (酢酸エチル : 酢酸 : 水 = 3 : 1 : 1) ;

NMR (300MHz, CD<sub>3</sub>OD) : δ 7.45 - 7.32 (m, 5H), 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.98 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 4.40 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 5 3.75 (m, 2H), 3.16 (m, 2H), 3.06 (m, 2H), 2.96 (s, 6H), 2.35 (s, 3H), 2.38 - 2.18 (m, 2H), 2.11 (s, 3H).

### 実施例2 (183)

8-(N-ベンジル-N-(2-ジメチルアミノエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・2塩酸塩  
10 ロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・2塩酸塩

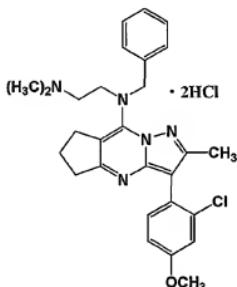


TLC : Rf 0.80 (酢酸エチル : 酢酸 : 水 = 3 : 1 : 1) ;  
 NMR(300MHz, CD<sub>3</sub>OD) : δ 7.60 - 7.30 (m, 6H), 7.19 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.08 - 7.02 (m, 1H), 5.13 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 4.94 (s, 2H), 4.40 - 4.24 (m, 2H), 3.87 (s, 3H), 3.76 (m, 1H), 3.56 (m, 1H), 2.99 (s, 3H), 2.98 (s, 3H), 2.44 (s, 3H).

5

実施例2 (184)

8-(N-ベンジル-N-(2-ジメチルアミノエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・2塩酸塩



10

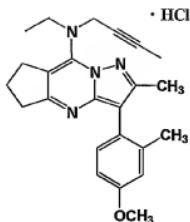
TLC : Rf 0.27 (クロロホルム : メタノール = 9 : 1) ;  
 NMR(300MHz, CD<sub>3</sub>OD) : δ 7.46 - 7.26 (m, 6H), 7.20 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.08 - 7.02 (m, 1H), 5.11 (brs, 2H), 4.34 - 4.20 (m, 2H), 3.87 (s, 3H), 3.76 - 3.64 (m, 2H), 3.34 - 2.86 (m) and 2.96 (s) total 10H, 2.41 (s, 3H), 2.26 - 2.10 (m, 2H).

15

実施例2 (185)

8-(N-(2-ブチニル)-N-エチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペン

## タ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

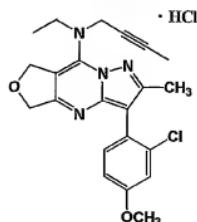


TLC : Rf 0.36 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.10 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (5) (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 4.55 (q, J = 2.1Hz, 2H), 4.08 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.48 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.22 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 2.17 (s, 3H), 1.90 (t, J = 2.1Hz, 3H), 1.47 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例2 (186)

10 8-(N-(2-ブチニル)-N-エチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-1H-ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

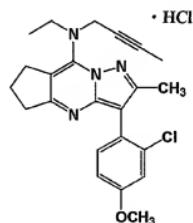


TLC : Rf 0.26 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 5.41 (s, 2H), 5.36 (m, 2H), 4.46 (m, 2H), 4.08 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.89 (t, J = 2.7Hz, 3H), 1.51 (t, J = 7.2Hz, 3H).

5 実施例2 (187)

8-(N-(2-ブチニル)-N-エチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



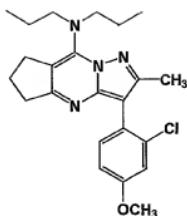
10 TLC : R f 0.32 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300Hz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.34 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 4.54 (m, 2H), 4.09 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.35 - 3.64 (m, 2H), 3.22 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.26 (m, 2H), 1.90 (t, J = 2.4Hz, 3H), 1.47 (t, J = 7.2Hz, 3H).

15

実施例2 (188)

8-(N,N-ジプロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

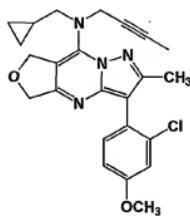


TLC : Rf 0.40 (ヘキサン : �酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.30 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.88 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.56 (m, 4H), 2.95 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 8.1Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.58 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.2Hz, 6H).

### 実施例2 (189)

8 - (N - (2 - プチニル) - N - シクロプロピルメチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5, 7 - 二ジヒドロ - 10  
10 ロ [3, 4 - d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン



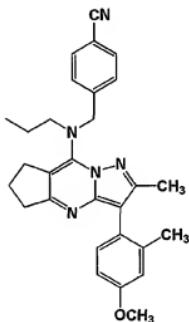
TLC : Rf 0.50 (トルエン : アセトン = 5 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.28 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.35 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.56 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.50 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 1.82 (t, J = 2.4Hz, 3H), 1.15 (m, 1H), 0.64 - 0.56 (m, 2H), 0.38

- 0.28 (m, 2H),

実施例 2 (190)

5 8 - (N-プロピル-N- (4-シアノフェニル) メチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン

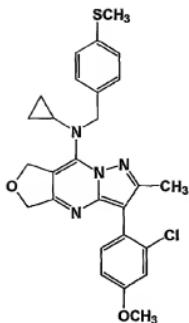


TLC : Rf 0.22 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.60 (brd, J = 8.1Hz, 2H), 7.47 (brd, J = 8.1Hz, 2H),  
10 7.17 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 4.90  
(s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.39 (m, 2H), 2.94 - 2.82 (m, 4H), 2.34 (s, 3H), 2.18 (s, 3H),  
2.11 (m, 2H), 1.59 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.2Hz, 3H).

実施例 2 (191)

15 8 - (N-シクロプロピル-N- (4-メチルチオフェニル) メチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 5, 7 - ジヒドロ - フロ [3, 4 - d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン

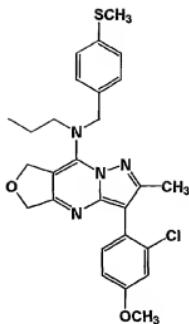


TLC : Rf 0.20 (ヘキサン : �酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.19 - 7.13 (m, 2H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.06 - 7.01 (m, 2H), 6.91 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 5.15 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.56 (m, 1H), 2.46 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 0.95 - 0.88 (m, 4H).

#### 実施例 2 (192)

- 8 - (N-プロピル-N- (4-メチルチオフェニル) メチルアミノ) - 2  
 10 - メチル - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロ  
 - フロ [3, 4 - d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン

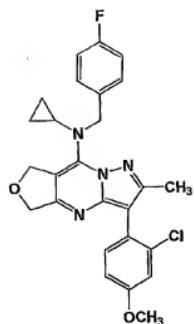


TLC : Rf 0.25 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.31 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.20 (s, 4H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.10 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 5 3.84 (s, 3H), 3.34 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 1.70 - 1.50 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 3H).

#### 実施例2 (193)

- 8 - (N-シクロプロピル-N- (4-フルオロフェニル) メチルアミノ)  
 10 - 2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

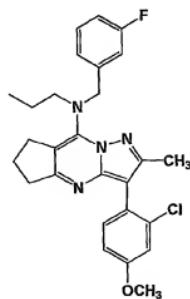


TLC : R<sub>f</sub> 0.19 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.14 - 7.04 (m, 3H), 7.02 - 6.94 (m, 2H), 6.92 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.19 (s, 2H), 5.16 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 5 3.84 (s, 3H), 2.55 (m, 1H), 2.41 (s, 3H), 0.90 - 0.76 (m, 4H).

#### 実施例2 (194)

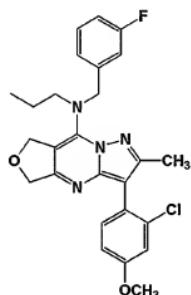
8 - (N-プロピル-N- (3-フルオロフェニル) メチルアミノ) - 2 -  
メチル-3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロー  
10 5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



TLC : R<sub>f</sub> 0.48 (ヘキサン : 酚酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.33 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.26 - 7.15 (m, 2H), 7.07 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.05 - 6.98 (m, 2H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.94 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.39 (m, 2H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.77 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.04 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.63 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.5Hz, 3H).

実施例2 (195)

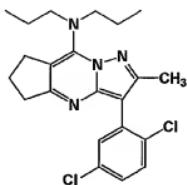
8-(N-プロピル-N-(3-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-10-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン



TLC : R<sub>f</sub> 0.46 (ヘキサン : 酚酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.28 - 7.16 (m, 2H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.07 - 6.99 (m, 2H), 6.91 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.07 (s, 2H), 5.04 (s, 2H), 4.88 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.13 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 1.68 (sext, J = 7.5Hz, 2H), 0.93 (t, J = 7.5Hz, 3H).

実施例2 (196)

8-ジプロピルアミノ-2-メチル-3-(2, 5-ジクロロフェニル)-  
6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリ  
ミジン



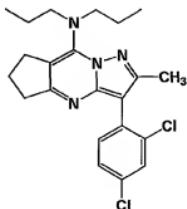
5 TLC : R<sub>f</sub> 0.64 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.41 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.40 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.23 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 3.60 - 3.52 (m, 4H), 2.96 (t, J = 7.8Hz) and 2.93 (t, J = 7.8Hz) total 4H, 2.37 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.65 - 1.50 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.2Hz, 6H).

10

実施例2 (197)

8-ジプロピルアミノ-2-メチル-3-(2, 4-ジクロロフェニル)-  
6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリ  
ミジン



15

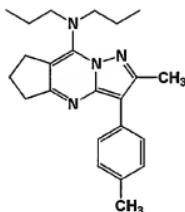
TLC : R<sub>f</sub> 0.57 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.51 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.35 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.29 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 3.65 - 3.50 (m, 4H), 2.96 (t, J = 7.2Hz) and 2.92 (t, J = 7.2Hz) total 4H, 2.36 (s, 3H), 2.14 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.63 - 1.45 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 6H).

5

### 実施例2 (198)

8-ジプロピルアミノ-2-メチル-3-(4-メチルフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロベンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン

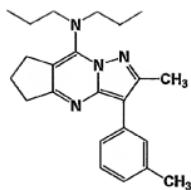


10 TLC : Rf 0.58 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.58 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.24 (d, J = 7.8Hz, 2H), 3.60 - 3.52 (m, 4H), 3.00 - 2.90 (m, 4H), 2.56 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.14 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.64 - 1.48 (m, 4H), 0.87 (t, J = 7.2Hz, 6H).

### 実施例2 (199)

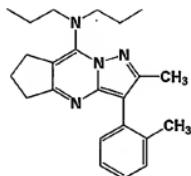
8-ジプロピルアミノ-2-メチル-3-(3-メチルフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロベンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



TLC : Rf 0.61 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.50 (s) and 7.47 (d, J = 7.5Hz) total 2H, 7.32 (t, J = 7.5Hz, 1H), 7.06 (t, J = 7.5Hz, 1H), 3.60 - 3.52 (m, 4H), 2.96 (t, J = 7.8Hz, 4H), 2.57 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.64 - 1.45 (m, 4H), 0.88 (t, J = 7.2Hz, 6H).

### 実施例 2 (200)

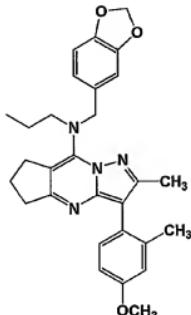
8-ジプロピルアミノ-2-メチル-3-(2-メチルフェニル)-6,7  
 10 一ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



TLC : Rf 0.56 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.35 - 7.20 (m, 4H), 3.62 - 3.54 (m, 4H), 2.96 (t, J = 7.2Hz) and 2.90 (t, J = 7.2Hz) total 4H, 2.34 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.13 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.63 - 1.50 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 6H).

### 実施例 2 (201)

8-(N-プロピル-N-(ベンゾ[d]1,3-ジオキソラン-5-イル)  
メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)  
-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ビ  
リミジン

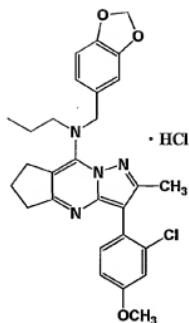


5

TLC : R<sub>f</sub> 0.31 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;  
NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.18 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.77 -  
6.83 (m, 2H), 6.67 - 6.75 (m, 2H), 5.94 (s, 2H), 4.74 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.37 (m,  
2H), 2.89 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.85 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.08  
10 (m, 2H), 1.58 (m, 2H), 0.88 (t, J = 7.2Hz, 3H).

### 実施例2(202)

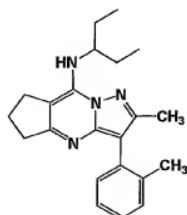
8-(N-プロピル-N-(ベンゾ[d]1,3-ジオキソラン-5-イル)  
メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)  
15 -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ビ  
リミジン・塩酸塩



TLC : R<sub>f</sub> 0.38 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.36 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.97  
 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 6.70 - 6.82 (m, 3H), 6.00 (s, 2H), 5.07 (s, 2H), 3.85 (s, 3H),  
 5 3.71 (m, 2H), 3.36 - 3.64 (m, 2H), 3.03 (t, J = 7.4Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.24 (m, 2H),  
 1.74 (m, 2H), 0.93 (t, J = 7.5Hz, 3H).

### 実施例2(203)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチルフェニル)-  
 10 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリ  
 ミジン



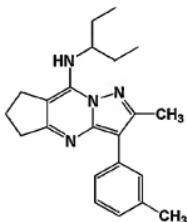
TLC : Rf 0.39 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.30 - 7.18 (m, 4H), 6.23 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.90 - 3.75 (m, 1H), 3.09 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.14 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.80 - 1.58 (m, 4H), 1.08 - 0.96 (m, 6H).

5

#### 実施例2 (204)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(3-メチルフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



10

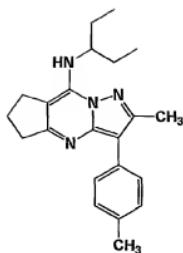
TLC : Rf 0.45 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.50 (s, 1H), 7.46 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.31 (t, J = 7.8Hz, 1H), 7.05 (d, J = 7.8Hz, 1H), 6.21 (d, J = 10.8Hz, 1H), 3.86 - 3.74 (m, 1H), 3.08 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.95 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.55 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.82 - 1.55 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 6H).

#### 実施例2 (205)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(4-メチルフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

20 ミジン

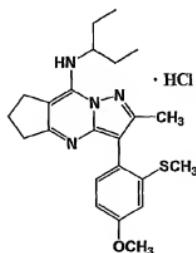


TLC : R<sub>f</sub> 0.47 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.57 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.24 (d, J = 7.8Hz, 2H), 6.20 (10.5Hz, 1H), 3.83 - 3.75 (m, 1H), 3.08 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.94 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.55 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.80 - 1.52 (m, 4H), 1.00 (t, J = 7.2Hz, 6H).

### 実施例2 (206)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチルチオ-4-メトキシフェニル)-7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

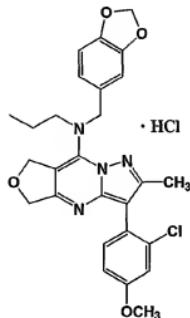


TLC : R<sub>f</sub> 0.10 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.26 - 7.16 (m, 1H), 6.83 (m, 1H), 6.84 - 6.76 (m, 1H), 3.97 (m, 1H), 3.86 (s, 3H), 3.48 (m, 2H), 3.12 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.28 (m, 2H), 1.95 - 1.44 (m, 4H), 1.11 - 0.99 (m, 6H)。

### 5 実施例 2 (207)

8-(N-プロピル-N-(ベンゾ[d]1,3-ジオキソラン-5-イル)  
メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)  
-5, 7-ジヒドローフロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジ  
ン・塩酸塩



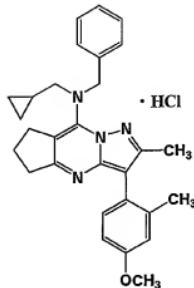
10

TLC : Rf 0.40 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;  
NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.95  
(dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 6.78 - 6.83 (m, 2H), 6.72 (m, 1H), 5.99 (s, 2H), 5.28 (m,  
2H), 5.16 (s, 2H), 5.04 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.60 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.77 (m,  
15 2H), 0.95 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

### 実施例 2 (208)

8-(N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3

— (2-メチル-4-メトキシフェニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

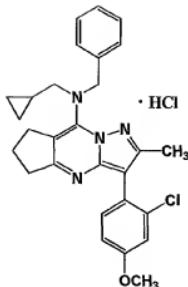


TLC : Rf 0.58 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

5 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.25 - 7.43 (m, 5H), 7.13 (d, J = 7.8Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.4, 7.8Hz, 1H), 5.28 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.69 (m, 2H), 3.48 (t, J = 8.1Hz, 2H), 3.07 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 2.19 (s, 3H), 1.16 (m, 1H), 0.63 (m, 2H), 0.18 (m, 2H).

#### 10 実施例2 (209)

8-(N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

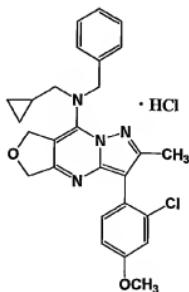


TLC : Rf 0.56 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.25 - 7.43 (m, 6H), 7.09 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.27 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.68 (m, 2H), 3.48 (m, 2H), 3.07 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.23 (m, 2H), 1.16 (m, 1H), 0.64 (m, 2H), 0.18 (m, 2H).

### 実施例2 (210)

8- (N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3  
10 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-フロ [3,  
4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



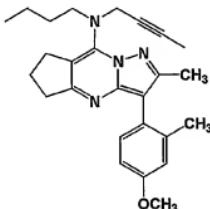
TLC : Rf 0.47 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.26 - 7.45 (m, 6H), 7.09 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 2.4, 8.1Hz, 1H), 5.36 (m, 2H), 5.28 (m, 2H), 5.23 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.69 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.21 (m, 1H), 0.66 (m, 2H), 0.22 (m, 2H).

5

実施例2 (2-1-1)

8-(N-ブチル-N-(2-ブチニル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



10

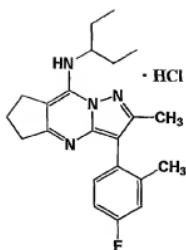
TLC : Rf 0.38 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.40 (brs, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.59 (m, 2H), 3.11 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.81 (t, J = 2.1Hz, 3H), 1.63 (m, 2H), 1.38 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.5Hz, 3H).

15

実施例2 (2-1-2)

8-(3-ベンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-フルオロフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩  
20

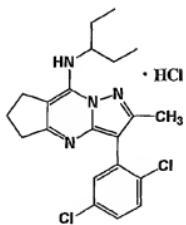


TLC : R<sub>f</sub> 0.44 (ヘキサン : �酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) : δ 7.34 - 7.24 (m, 2H), 7.20 - 7.10 (m, 1H), 4.03 - 3.85  
 (m, 1H), 3.14 (brt, J = 8.1Hz, 2H), 2.95 (brt, J = 8.1Hz, 2H), 2.25 (s, 3H), 2.25 - 2.10  
 (m) and 2.12 (s) total 5H, 1.85 - 1.60 (m, 4H), 0.95 - 0.85 (m, 6H).

### 実施例2 (2-13)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2,5-ジクロロフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロベンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

#### 10 ピリミジン・塩酸塩

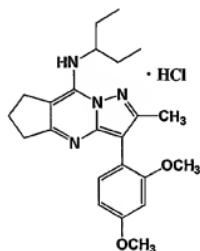


TLC : R<sub>f</sub> 0.46 (ヘキサン : �酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) : δ 7.68 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.62 - 7.55 (m) and 7.59 (s)  
 total 2H, 4.03 - 3.85 (m, 1H), 3.14 (brt, J = 7.8Hz, 2H), 2.96 (brt, J = 7.8Hz, 2H),

2.32 (s, 3H), 2.25 - 2.10 (m, 2H), 1.85 - 1.60 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

#### 実施例2 (214)

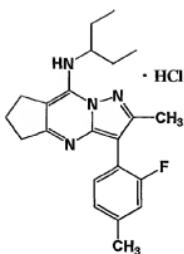
- 5 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2,4-ジメトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



- TLC : R<sub>f</sub> 0.43 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;  
 NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) : δ 7.24 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.71 (d, J = 2.4Hz, 1H),  
 10 6.66 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 4.05 - 3.85 (m, 1H), 3.85 (s, 3H), 3.74 (s, H), 3.15 (brt,  
 J = 8.1Hz, 2H), 2.99 (brt, J = 8.1Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.25 - 2.10 (m, 2H), 1.85 -  
 1.63 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

#### 実施例2 (215)

- 15 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-フルオロ-4-メチルフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

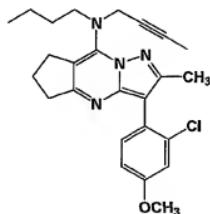


TLC : R<sub>f</sub> 0.43 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) : δ 9.20 - 9.00 (m, 1H), 7.39 (t, J = 7.8Hz, 1H), 7.22 (d, J = 11.1Hz, 1H), 7.17 (d, J = 7.8Hz, 1H), 4.05 - 3.60 (m, 1H, covered with H<sub>2</sub>O in DMSO-d<sub>6</sub>), 3.14 (brt, J = 7.8Hz, 2H), 2.99 (brt, J = 7.8Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 2.18 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.83 - 1.60 (m, 4H), 0.89 (t, J = 7.5Hz, 6H),

#### 実施例2 (216)

8-(N-ブチル-N-(2-ブチニル)アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



TLC : R<sub>f</sub> 0.80 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

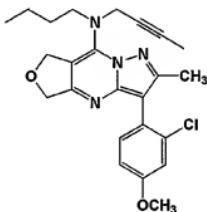
NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.88

(dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 4.39 (q, J = 2.1Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.59 (m, 2H), 3.11 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.93 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.14 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.81 (t, J = 2.1Hz, 3H), 1.68 - 1.54 (m, 2H), 1.39 (sext, J = 7.5Hz, 2H), 0.94 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

5

### 実施例2 (217)

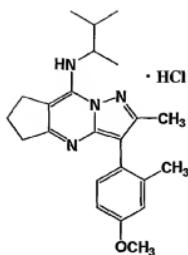
8-(N-ブチル-N-(2-ブチニル)アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



10

TLC : R<sub>f</sub> 0.78 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;  
 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.28 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.33 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.44 (q, J = 2.4Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.54 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.82 (t, J = 2.4Hz, 3H), 1.74 - 1.61 (m, 2H), 1.41 (sext, J = 7.5Hz, 2H), 0.96 (t, J = 7.5Hz, 3H).

15  
実施例2 (218)  
 8-(3-メチル-2-ブチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩  
 20

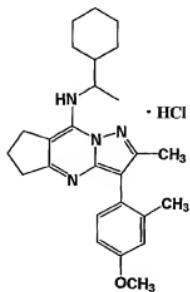


TLC : Rf 0.36 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.45 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 7.11 (dd J = 4.2, 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 4.07 (m, 1H), 3.83 (s, 1H), 3.49 (m, 2H), 3.15 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.29 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.20 and 2.19 (s, total 3H), 1.99 (m, 1H), 1.42 and 1.41 (d, J = 6.6Hz, total 3H), 1.05 - 1.14 (m, 6H).

### 実施例2 (219)

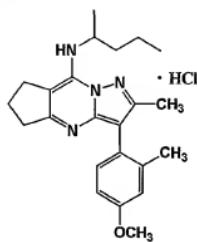
8-(1-シクロヘキシルエチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.36 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.42 (brd, J = 10.5Hz, 1H), 7.11 and 7.10 (d, J = 8.1Hz, total 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 4.03 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.48 (m, 2H), 3.12 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.28 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.20  
 5 and 2.18 (s, total 3H), 1.52 - 1.95 (m, 6H), 1.41 and 1.40 (d, J = 6.6Hz, total 3H), 1.01 - 1.37 (m, 5H).

#### 実施例2 (220)

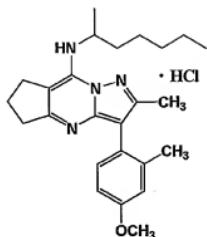
8-(2-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.36 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.34 (brd, J = 9.6Hz, 1H), 7.11 and 7.10 (d, J = 8.7Hz, total 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 4.25 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.49 (m, 2H), 3.16 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.29 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.20 and 2.19 (s, total 3H), 1.70 - 1.80 (m, 2H), 1.44 - 1.58 (m, 2H), 1.47 and 1.46 (d, J = 6.6Hz, total 3H), 1.01 (m, 3H).

20 実施例2 (221)

8-(2-ヘプチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



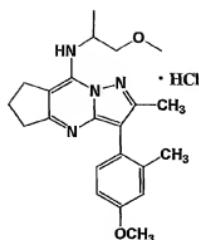
5 TLC : R<sub>f</sub> 0.43 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 7.12 and 7.11 (d, J = 8.4Hz, total 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 4.22 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.50 (m, 2H), 3.15 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.29 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.20 and 2.19 (s, total 3H), 1.71 - 1.81 (m, 2H), 1.30 - 1.55 (m, 9H), 0.92 (m, 3H).

10

### 実施例2(2.2)

8-(1-メトキシ-2-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

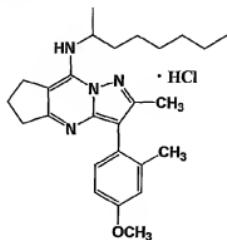


TLC : Rf 0.30 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.66 (brd, J = 8.4Hz, 1H), 7.11 and 7.10 (d, J = 8.7Hz, total 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 4.46 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.64 (dd, J = 3.9, 9.9Hz, 1H), 3.42 - 3.58 (m, 3H), 3.46 and 3.45 (s, total 3H), 3.23 (m, 1H), 3.11 (m, 1H), 2.29 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.19 and 2.18 (s, total, 3H), 1.49 (d, J = 6.6Hz, 3H).

### 実施例2(223)

- 10 8-(2-オクチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

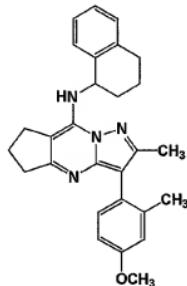


TLC : Rf 0.60 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.33 (brd, J = 10.2Hz, 1H), 7.12 and 7.11 (d, J = 8.1Hz, total 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 4.23 (m, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.50 (brt, J = 7.2Hz, 2H), 3.15 (t, J = 6.6Hz, 2H), 2.29 (m, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.20 and 2.19 (s, total 3H), 1.75 (m, 2H), 1.46 and 1.45 (d, J = 6.3Hz, total 3H),  
 5 1.26 - 1.45 (m, 8H), 0.90 (m, 3H).

実施例2 (224)

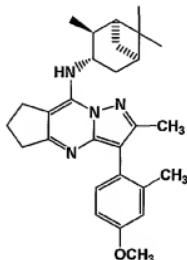
8-(1, 2, 3, 4-テトラヒドロナフタレン-1-イル)アミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-  
 10 5H-シクロヘンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



TLC : R f 0.16 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.44 (m, 1H), 7.27 - 7.14 (m, 4H), 6.85 (d, J = 2.7Hz,  
 1H), 6.78 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 6.69 (brd, J = 9.9Hz, 1H), 5.22 (m, 1H), 3.82 (s,  
 15 3H), 3.24 - 3.08 (m, 2H), 3.00 - 2.76 (m, 4H), 2.26 (s, 3H), 2.24 - 1.82 (m, 6H), 2.20  
 (s, 3H).

実施例2 (225)

8 - ( ( 1 S, 2 S, 3 S, 5 R) - 2, 6, 6 - トリメチルビシクロ [3.1.1] - 3 - ヘプチル ) アミノ - 2 - メチル - 3 - ( 2 - メチル - 4 - メトキシフェニル ) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン

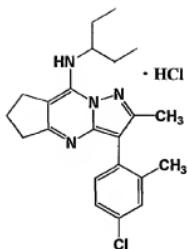


5

TLC : Rf 0.25 (ヘキサン : �酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.85 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 6.35 (brd, J = 10.8Hz, 1H), 4.31 (m, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.22 - 3.06 (m, 2H), 2.91 (t, J = 8.1Hz, 2H), 2.62 - 2.46 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.19 (s, 3H),  
 10 2.19 - 1.82 (m, 6H), 1.29 (s, 3H), 1.20 (d, J = 6.0Hz, 3H), 1.11 - 1.08 (m, 1H), 1.09 (s, 3H).

### 実施例2 (226)

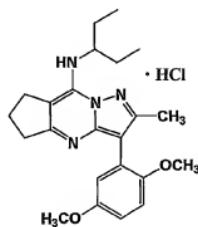
8 - ( 3 - ベンチルアミノ ) - 2 - メチル - 3 - ( 2 - メチル - 4 - クロロフェニル ) - 6, 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン・塩酸塩



TLC : R<sub>f</sub> 0.41 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.38 - 7.32 (m, 2H), 7.26 - 7.10 (m, 2H), 4.04 - 3.90  
 (m, 1H), 3.60 - 3.30 (m, 2H), 3.13 (t, J = 6.6Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.28  
 5 (quint, J = 6.6Hz, 2H), 1.92 - 1.40 (m, 4H), 1.06 (t, J = 7.2Hz, 6H).

#### 実施例2 (227)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2,5-ジメトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ビリミジン・塩酸塩



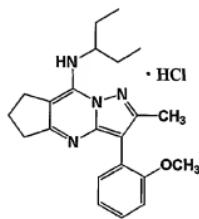
TLC : R<sub>f</sub> 0.52 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 - 7.24 (m, 1H), 7.00 - 6.90 (m, 2H), 6.85 (d, J = 2.4Hz, 1H), 4.05 - 3.95 (m, 1H), 3.90 (s, 3H), 3.84 (s, 3H), 3.56 (t, J = 7.8Hz, 2H),

3.12 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.29 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.90 - 1.40 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

### 実施例2 (228)

- 5 8-(3-ベンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メトキシフェニル)-  
-6-, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ビ  
リミジン・塩酸塩

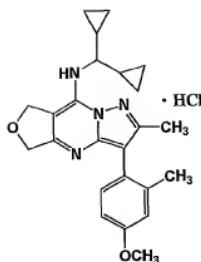


TLC : Rf 0.24 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1) ;

- 10 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.41 (t, J = 8.1Hz, 1H), 7.34 - 7.24 (m, 2H), 7.10 - 7.02 (m, 2H), 4.03 - 3.90 (m, 1H), 3.94 (s, 3H), 3.56 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.12 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.36 - 2.20 (m, 2H), 1.90 - 1.40 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

### 実施例2 (229)

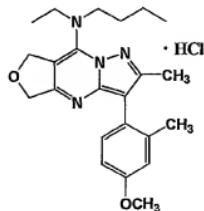
8-ジシクロプロピルメチルアミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-  
メトキシフェニル)-5-, 7-ジヒドロ-フロ[3, 4-d]ピラゾロ[1,  
5-a]ビリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.46 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.87 (m, 1H), 7.11 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 5.37 (s, 2H), 5.19 (m, 2H), 3.83 (s, 3H),  
 5 2.90 (m, 1H), 2.36 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.26 (m, 2H), 0.66 - 0.85 (m, 4H), 0.47 (m, 4H)。

### 実施例2 (230)

10 8-(N-ブチル-N-エチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7ジヒドロ-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩  
 [1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

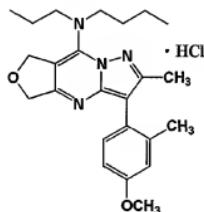


TLC : Rf 0.49 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.10 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82

(dd,  $J = 2.7, 8.7\text{Hz}$ , 1H), 5.40 (s, 2H), 5.23 (s, 2H), 3.85 - 4.00 (m, 4H), 3.83 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.82 (m, 2H), 1.46 ( $t, J = 6.9\text{Hz}$ , 3H), 1.44 (m, 2H), 1.02 ( $t, J = 6.9\text{Hz}$ , 3H)。

### 5 実施例 2 (2 3 1)

8-(N-ブチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ[1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



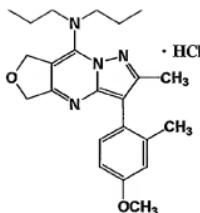
10 TLC : R<sub>f</sub> 0.54 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) :  $\delta$  7.10 (d,  $J = 8.4\text{Hz}$ , 1H), 6.89 (d,  $J = 2.4\text{Hz}$ , 1H), 6.82 (dd,  $J = 2.4, 8.4\text{Hz}$ , 1H), 5.40 (s, 2H), 5.21 (s, 2H), 3.87 (m, 4H), 3.83 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.82 (m, 4H), 1.42 (m, 2H), 1.02 ( $t, J = 7.2\text{Hz}$ , 3H), 1.00 ( $t, J = 7.2\text{Hz}$ , 3H)。

15

### 実施例 2 (2 3 2)

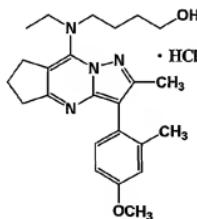
8-(N, N-ジプロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ[1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



TLC : R<sub>f</sub> 0.51 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.10 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.82  
 (dd, J = 3.0, 8.4Hz, 1H), 5.39 (brs, 2H), 5.21 (brs, 2H), 3.85 (m, 4H), 3.83 (s, 3H),  
 5 2.29 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.83 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.2Hz, 6H).

### 実施例2 (233)

8 - (N-エチル-N-(4-ヒドロキシブチル)アミノ)-2-メチル-  
 3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シリ  
 10 クロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

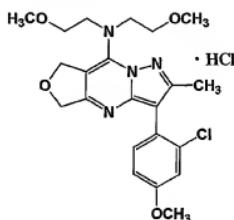


TLC : R<sub>f</sub> 0.29 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 2) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.10 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.87 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.79  
 (dd, J = 3.0, 8.4Hz, 1H), 3.87 - 4.01 (m, 4H), 3.82 (s, 3H), 3.65 (t, J = 6.0Hz, 2H),  
 15 3.38 (t, J = 7.5Hz, 2H), 3.06 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.27 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 2.17 (s,

3H), 1.86 (m, 2H), 1.61 (m, 2H), 1.38 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

### 実施例 2 (2 3 4)

- 8-ビス(2-メトキシエチル)アミノ-2-メチル-3-(2-クロロ-  
5 4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ  
[1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

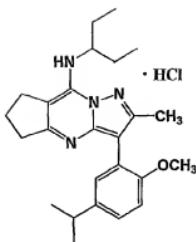


TLC : Rf 0.35 (ヘキサン : 酮酸エチル = 1 : 2) ;

- NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.33 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.96  
10 (dd, J = 2.4, 8.4Hz, 1H), 5.40 (m, 1H), 5.33 (m, 1H), 5.25 (m, 2H), 4.15 (m, 4H),  
3.85 (s, 3H), 3.71 (t, J = 5.1Hz, 4H), 3.35 (s, 6H), 2.35 (s, 3H)。

### 実施例 2 (2 3 5)

- 8-(3-ベンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メトキシ-5-イソ  
15 プロピルフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾ  
ロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

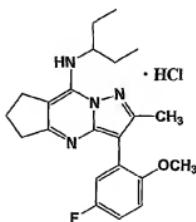


TLC : R<sub>f</sub> 0.36 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.23 (dd, J = 8.4, 2.1Hz, 1H), 7.12 (d, J = 2.1Hz, 1H),  
6.98 (d, J = 8.4Hz, 1H), 4.00 - 3.85 (m) and 3.91 (s) total 4H, 3.58 - 3.30 (m, 2H),  
5 3.11 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.92 (m, 1H), 2.43 (s, 3H), 2.35 - 2.20 (m, 2H), 1.90 - 1.50  
(m, 4H), 1.26 (d, J = 6.9Hz, 6H), 1.04 (t, J = 7.5Hz, 6H).

### 実施例2 (236)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メトキシ-5-フル  
10 オロフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,  
5-a]ピリミジン・塩酸塩



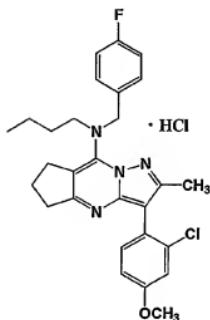
TLC : R<sub>f</sub> 0.26 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.20 - 6.95 (m, 4H), 4.04 - 3.80 (m) and 3.91 (s) total

4H, 3.52 - 3.40 (m, 2H), 3.12 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.27 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.90 - 1.40 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 6H).

### 実施例2 (237)

- 5 8-(N-ブチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-5-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

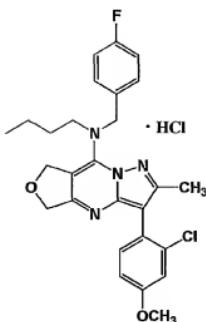


TLC : Rf 0.40 (ヘキサン:酢酸エチル=3:1) ;

- 10 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.44 - 7.20 (m, 3H), 7.14 - 6.90 (m, 4H), 5.03 (brs, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.62 (m, 2H), 3.29 (m, 2H), 2.96 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.19 (m, 2H), 1.65 (m, 2H), 1.32 (m, 2H), 0.90 (m, 3H),

### 実施例2 (238)

- 15 8-(N-ブチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

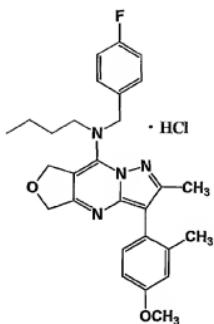


TLC : R<sub>f</sub> 0.20 (ヘキサン : �酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.40 - 7.26 (m, 3H), 7.12 (brd, J = 7.8Hz, 2H), 7.09 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.99 - 6.92 (m, 1H), 5.40 (m, 2H), 5.30 - 5.08 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 5 3.70 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.76 (m, 2H), 1.36 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.5Hz, 3H).

### 実施例2 (239)

8 - (N-ブチル-N- (4-フルオロフェニル) メチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 5, 7 - ジヒドロ - 10 ロ [3, 4 - d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン・塩酸塩

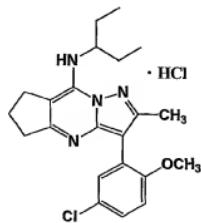


TLC : Rf 0.28 (ヘキサン : �酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.29 (m, 2H), 7.18 - 7.04 (m, 3H), 6.89 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.85 - 6.78 (m, 1H), 5.23 (m, 2H), 5.15 (m, 2H), 5.11 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 5 3.58 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.71 (m, 2H), 1.35 (m, 2H), 0.95 - 0.84 (m, 3H).

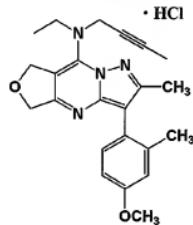
### 実施例2 (240)

8-(3-ベンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メトキシ-5-クロロフェニル)-6,7ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



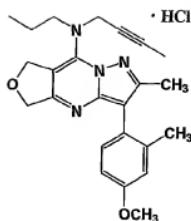
TLC : Rf 0.26 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.33 (dd, J = 9.0, 3.0Hz, 1H), 7.25 - 7.05 (m) and 7.22 (d, J = 3.0Hz) total 2H, 6.98 (d, J = 9.0Hz, 1H), 4.03 - 3.85 (m) and 3.93 (s) total 4H, 3.55 - 3.40 (m, 2H), 3.13 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.28 (quint, J = 7.2Hz, 2H),  
 5 1.90 - 1.40 (m, 4H), 1.05 (t, J = 7.5Hz, 6H).

実施例 2 (241)  
 8-(N-エチル-N-(2-ブチリル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドローフロ [3, 4-d]  
 10 ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.37 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.10 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.41 (s, 4H), 4.48 (m, 2H), 4.14 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.90 (t, J = 2.4Hz, 3H), 1.54 (t, J = 7.2Hz, 3H).  
 15

実施例 2 (242)  
 8-(N-プロピル-N-(2-ブチリル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドローフロ [3, 4-d]  
 20 ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

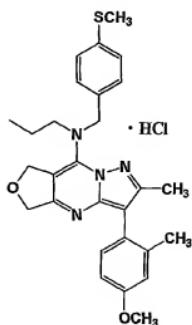


TLC : R<sub>f</sub> 0.47 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.10 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 5.41 (m, 2H), 5.39 (m, 2H), 5.42 (m, 2H), 3.98 (m, 2H), 5 3.83 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.94 (m, 2H), 1.89 (t, J = 2.7Hz, 3H), 1.05 (t, J = 7.2Hz, 3H).

#### 実施例 2 (2.4.3)

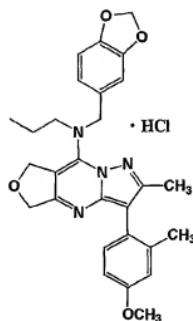
8 - (N-プロピル-N- (4-メチルチオフェニル) メチルアミノ) - 2  
10 - メチル - 3 - (2-メチル - 4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロ  
- フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.45 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.27 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.20 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.12  
 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.40 (s,  
 2H), 5.11 - 5.26 (m, 4H), 3.84 (s, 3H), 3.70 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.20  
 (s, 3H), 1.84 (m, 2H), 0.97 (t, J = 7.2Hz, 3H).

### 実施例2(244)

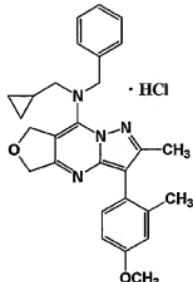
8-(N-プロピル-N-(ベンゾ[d]1,3-ジオキソラン-5-イル)  
 メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)  
 10 -5, 7-ジヒドロ-フロ[3, 4-d]ビラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.45 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.13 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83  
 15 (dd, J = 2.7, 8.1Hz, 1H), 6.82 (d, J = 7.5Hz, 1H), 6.78 (d, J = 1.5Hz, 1H), 6.73 (dd, J  
 = 1.5, 7.5Hz, 1H), 6.01 (s, 2H), 5.39 (s, 2H), 5.17 (s, 2H), 5.11 (m, 2H), 3.84 (s, 3H),  
 3.69 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.21 (s, 3H), 1.81 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.2Hz, 3H).

実施例2(245)

8-(N-ベンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-  
 -(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-フロ[3,  
 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩

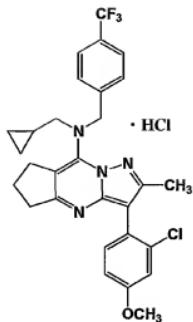


5

TLC : Rf 0.47 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;  
 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.34 - 7.46 (m, 3H), 7.26 - 7.33 (m, 2H), 7.13 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.84 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H), 5.42 (s, 2H), 5.33 (m, 2H), 5.24 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.73 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.24 (m, 1H), 0.69 (m, 2H), 0.24 (m, 2H).

実施例2(246)

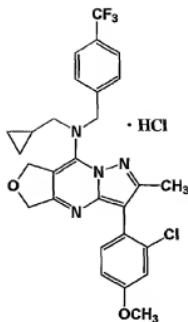
8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)  
 メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-5-メトキシフェニル)-  
 15-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピ  
 リミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.48 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.62 (brd, J = 7.8Hz, 2H), 7.48 (brd, J = 7.8Hz, 2H),  
 7.34 (brd, J = 8.1Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.90 - 6.88 (m, 1H), 5.19 (brs, 2H),  
 5 3.85 (s, 3H), 3.54 (m, 2H), 3.36 - 3.14 (m, 2H), 3.14 - 2.98 (m, 2H), 2.36 (s, 3H),  
 2.22 (m, 2H), 1.12 - 0.98 (m, 1H), 0.64 - 0.52 (m, 2H), 0.18 - 0.08 (m, 2H).

### 実施例2(247)

- 8 - (N - シクロプロピルメチル - N - (4 - トリフォルオロメチルフェニル)  
 10 メチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル)  
 - 5, 7 - ジヒドロ - フロ [3, 4 - d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジ  
 ン・塩酸塩

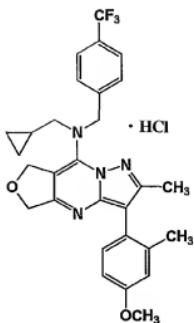


TLC : Rf 0.42 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.65 (brd, J = 7.5Hz, 2H), 7.49 (brd, J = 7.5Hz, 2H),  
7.33 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.35 -  
5 5.18 (m, 6H), 3.85 (s, 3H), 3.54 (d, J = 6.6Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.11 (m, 1H), 0.72 -  
0.60 (m, 2H), 0.22 - 0.14 (m, 2H).

### 実施例2 (248)

- 8 - (N-シクロプロピルメチル-N- (4-トリフルオロメチルフェニル)  
10 メチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル)  
- 5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジ  
ン・塩酸塩

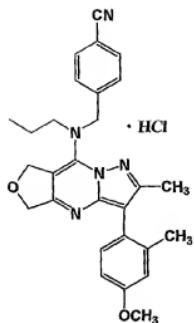


TLC : Rf 0.42 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.68 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.49 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.12 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.83 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.42 (m, 2H), 5.38 (s, 2H), 5.27 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.61 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.15 (m, 1H), 0.74 - 0.66 (m, 2H), 0.26 - 0.18 (m, 2H).

### 実施例2 (249)

- 8-(N-プロピル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-1-オクタゾロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩  
10

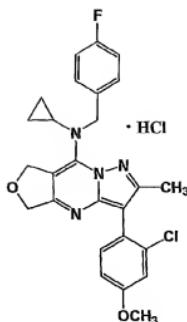


TLC : Rf 0.29 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.66 (brd, J = 7.8Hz, 2H), 7.49 (brd, J = 7.8Hz, 2H),  
 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.15  
 5 (brs, 2H), 5.09 (brs, 2H), 5.01 (brs, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.37 (m, 2H), 2.33 (s, 3H),  
 2.18 (s, 3H), 1.74 - 1.60 (m, 2H), 0.91 (t, J = 6.9Hz, 3H).

### 実施例2 (250)

- 8-(N-シクロプロピル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)  
 10 -2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロロ-3,4-d]ビラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

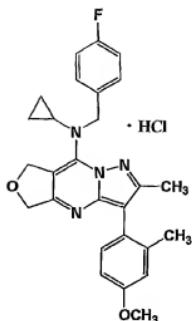


TLC : Rf 0.40 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.16 - 7.07 (m, 3H), 7.02 - 6.94 (m 2H), 6.92 (dd, J = 8.4, 3.0Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 5.18 (s, 2H), 4.94 (s, 2H), 5 3.84 (s, 3H), 2.56 (m, 1H), 2.41 (s, 3H), 0.89 - 0.79 (m, 4H).

#### 実施例2 (251)

- 8 - (N - シクロプロピル - N - (4 - フルオロフェニル) メチルアミノ)  
 - 2 - メチル - 3 - (2 - メチル - 4 - メトキシフェニル) - 5, 7 - 二ヒドロ -  
 10 ドローフロ [3, 4 - d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン・塩酸塩

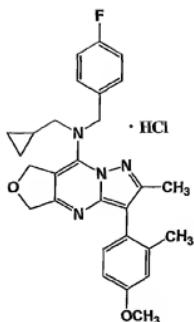


TLC : Rf 0.44 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.19 - 7.08 (m, 3H), 7.04 - 6.96 (m, 2H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.28 - 5.18 (m, 4H), 5.00 (s, 2H), 3.83 (s, 5 - 3H), 2.60 (m, 1H), 2.38 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 0.90 - 0.80 (m, 4H).

### 実施例2 (252)

8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7  
10 10-ジヒドロ-フロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸  
塩

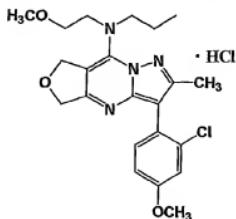


TLC : Rf 0.49 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.36 - 7.29 (m, 2H), 7.15 - 7.05 (m, 3H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.84 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.39 (s, 2H), 5.32 - 5.20 (m, 4H), 3.84 (s, 5 H), 3.62 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.20 - 1.08 (m, 1H), 0.72 - 0.62 (m, 2H), 0.28 - 0.18 (m, 2H).

### 実施例 2 (25-3)

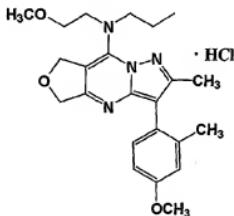
8-(N-プロピル-N-(2-メトキシエチル)アミノ)-2-メチル-10  
10 3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-プロ[3,  
4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.35 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.34 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.97  
 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 5.48 (d, J = 16.8Hz, 1H), 5.36 (d, J = 16.8Hz, 1H), 5.23 (s,  
 2H), 4.38 - 4.22 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.78 - 3.66 (m, 4H), 3.34 (s, 3H), 2.35 (s, 3H),  
 5 1.81 (sext, J = 7.5Hz, 2H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 3H).

実施例 2 (254)

8 - (N-プロピル-N- (2-メトキシエチル) アミノ) - 2-メチル-  
 3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロフロ [3,  
 10 4 - d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

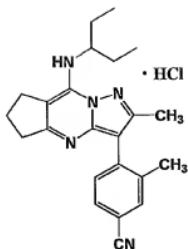


TLC : Rf 0.33 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.83  
 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H) 5.41 (s, 2H), 5.22 (s, 2H), 4.30 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.80 -  
 15 3.60 (m, 4H), 3.34 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.81 (sext, J = 7.5Hz, 2H), 1.01  
 (t, J = 7.5Hz, 3H).

実施例 2 (255)

8 - (3-ペンチルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-シアノ  
 20 フェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1,

## 5-a] ピリミジン・塩酸塩

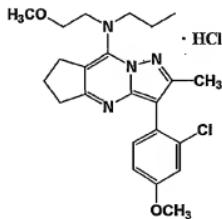


TLC : R<sub>f</sub> 0.45 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.65 (s, 1H), 7.57 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.34 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.24 - 7.08 (m, 1H), 4.06 - 3.88 (m, 1H), 3.41 (brt, J = 7.2Hz, 2H), 3.15 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.40 - 2.20 (m) and 2.30 (s) total 8H, 1.90 - 1.40 (m, 4H), 1.06 (t, J = 6.6Hz, 6H).

実施例2(256)

10 8-(N-プロピル-N-(2-メトキシエチル)アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-5-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



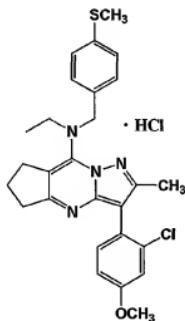
TLC : R<sub>f</sub> 0.46 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.34 (brd, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.99 - 6.91 (m, 1H), 4.20 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.75 (m, 2H), 3.62 (m, 2H), 3.52 - 3.30 (m, 2H), 3.30 (s, 3H), 3.03 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.24 (m, 2H), 1.72 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

5

実施例2 (257)

8-(N-エチル-N-(4-メチルオフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



10

TLC : Rf 0.42 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

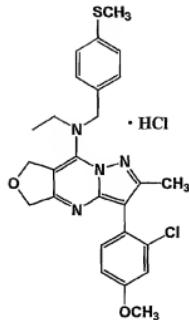
NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.40 - 7.30 (m, 1H), 7.30 - 7.16 (m, 4H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.99 - 6.92 (m, 1H), 5.11 (brs, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.78 (m, 2H), 3.42 (m, 2H), 3.00 (m, 2H), 2.50 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.21 (m, 2H), 1.34 (m, 3H),

15

実施例2 (258)

8-(N-エチル-N-(4-メチルオフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-

プロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

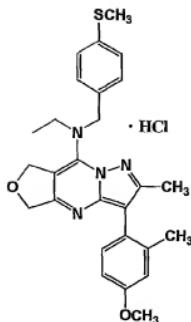


TLC : Rf 0.35 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.35 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.28 (brd, J = 8.1Hz, 2H),  
 5 7.21 (brd, J = 8.1Hz, 2H), 7.09 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.97 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.48  
 - 5.27 (m, 2H), 5.27 - 5.06 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 3.88 - 3.78 (m, 2H), 2.50 (s, 3H),  
 2.36 (s, 3H), 1.42 (t, J = 6.9Hz, 3H).

### 実施例2 (259)

10 8-(N-エチル-N-(4-メチルチオフェニル)メチルアミノ)-2-  
 メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロー-  
 プロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

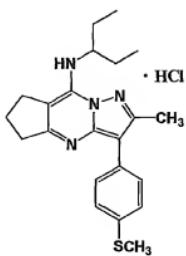


TLC : Rf 0.40 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.28 (brd, J = 8.4Hz, 2H), 7.22 (brd, J = 8.4Hz, 2H), 7.13 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.84 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H),  
5.40 (brs, 2H), 5.22 - 5.08 (m, 4H), 3.86 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.50 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.43 (t, J = 6.6Hz, 3H).

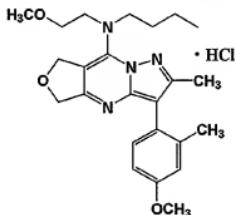
### 実施例2 (260)

8-(3-ベンチルアミノ)-2-メチル-3-(4-メチルチオフェニル)  
10 -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロパンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピ  
リミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.46 (ヘキサン : �酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.52 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.39 (d, J = 8.4Hz, 2H), 7.31  
 (d, J = 10.5Hz, 1H), 4.06 - 3.90 (m, 1H), 3.60 (t, J = 7.8Hz, 2H), 3.13 (t, J = 7.8Hz,  
 2H), 2.52 (s, 3H), 2.49 (s, 3H), 2.30 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.94 - 1.64 (m, 4H), 1.05  
 5 (t, J = 7.2Hz, 6H).

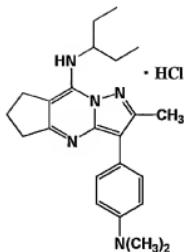
実施例2 (261)  
 8 - (N-ブチル-N- (2-メトキシエチル) アミノ) -2-メチル-3  
 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) -5, 7-ジヒドロ-フロ [3,  
 10 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.61 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 2) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82  
 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.40 (s, 2H), 5.22 (s, 2H), 4.29 (m, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.78  
 15 (m, 2H), 3.72 (t, J = 5.1Hz, 2H), 3.34 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.77  
 (quintet, J = 7.5Hz, 2H), 1.42 (sixtet, J = 7.5Hz, 2H), 1.00 (t, J = 7.5Hz, 3H).

実施例2 (262)  
 8 - (3-ベンチルアミノ) -2-メチル-3 - (4-ジメチルアミノフェ  
 20 ニル) -6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-

## a] ピリミジン・塩酸塩

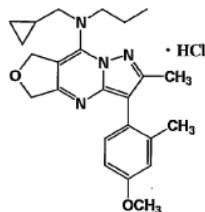


TLC : Rf 0.57 (ヘキサン : 酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.72 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.60 - 7.40 (m, 2H), 6.88 - 5.75 (m, 1H), 3.98 - 3.85 (m, 1H), 3.35 - 3.25 (m, 2H), 3.15 - 3.05 (m) and 3.13 (s) total 8H, 2.52 (s, 3H), 2.25 (quint, J = 7.8Hz, 2H), 1.85 - 1.60 (m, 4H), 1.03 (t, J = 7.5Hz, 6H).

実施例2 (263)

- 10 8-(N-シクロプロピルメチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3- (2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



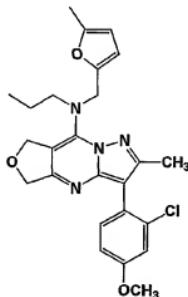
TLC : Rf 0.55 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.15 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 5.04 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.69 - 3.63 (m, 4H), 2.33 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.70 (sixt, J = 7.5Hz, 2H), 1.07 (m, 1H), 0.96 (t, J = 7.5Hz, 3H), 0.56 (m, 2H), 0.20 (m, 2H)。

5

実施例2 (264)

8-(N-プロピル-N-(5-メチルフラン-2-イル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



10

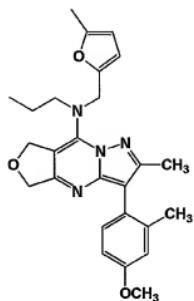
TLC : R<sub>f</sub> 0.47 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.31 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 6.02 (d, J = 3.0Hz, 1H), 5.86 (m, 1H), 5.08 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.26 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.23 (s, 3H), 1.66 (m, 2H), 15 0.94 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例2 (265)

8-(N-プロピル-N-(5-メチルフラン-2-イル)メチルアミノ)

—2—メチル—3—(2—メチル—4—メトキシフェニル)—5, 7—ジヒドロ—フロ [3, 4—d] ピラゾロ [1, 5—a] ピリミジン

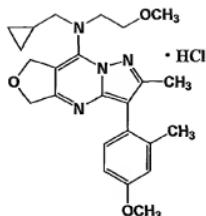


TLC : Rf 0.49 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

5 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.18 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.81 (d, J = 2.4, 8.1Hz, 1H), 6.01 (d, J = 3.0Hz, 1H), 5.86 (m, 1H), 5.07 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 4.88 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.25 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.22 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.67 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.5Hz, 3H),

#### 10 実施例2 (266)

8—(N—シクロプロピルメチル—N—(2—メトキシエチル) アミノ)—2—メチル—3—(2—メチル—4—メトキシフェニル)—5, 7—ジヒドロ—フロ [3, 4—d] ピラゾロ [1, 5—a] ピリミジン・塩酸塩

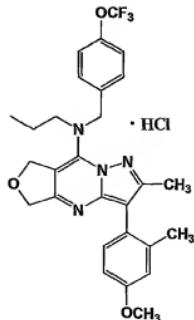


TLC : Rf 0.29 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.16 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.80 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 4.05 (t, J = 5.4Hz, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.56 (t, J = 5.4Hz, 2H), 3.48 (d, J = 6.9 Hz, 2H), 3.29 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.04 (m, 1H), 0.56 (m, 2H), 0.22 (m, 2H).

### 実施例 2 (267)

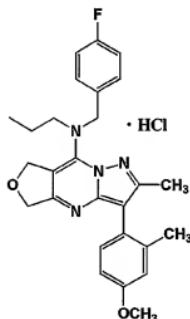
8 - (N-プロピル-N- (4-トリフルオロメチルオキシフェニル) メチ  
10 ルアミノ) - 2-メチル-3 - (2-メチル-4-メトキシフェニル) - 5,  
7-ジヒドロフローフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩  
酸塩



TLC : Rf 0.51 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.36 (brd, J = 8.1Hz, 2H), 7.18 (brd, J = 8.1Hz, 2H),  
 7.17 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.13  
 (brs, 2H), 4.97 (brs, 2H), 4.92 (brs, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.34 (m, 2H), 2.36 (s, 3H),  
 5 2.18 (s, 3H), 1.64 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 3H).

実施例 2 (268)

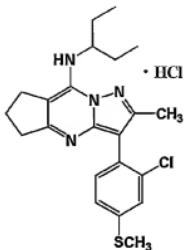
8-(N-プロピル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-  
 メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロー  
 10 フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.53 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 - 7.22 (m, 2H), 7.17 (brd, J = 8.7Hz, 1H), 7.02  
 (m, 2H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (brd, J = 8.7Hz, 1H), 5.11 (brs, 2H), 4.95 (brs,  
 15 4H), 3.83 (s, 3H), 3.34 (m, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.65 (m, 2H), 0.90 (t, J =  
 6.9Hz, 3H).

実施例 2 (269)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メチルチオフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

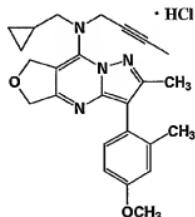


5 TLC : Rf 0.64 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.40 - 7.34 (m, 2H), 7.33 - 7.24 (m, 2H), 3.99 (m, 1H), 3.66 - 3.35 (m, 2H), 3.13 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.52 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.30 (m, 2H), 1.94 - 1.64 (m, 4H), 1.10 - 1.00 (m, 6H).

#### 10 実施例2 (270)

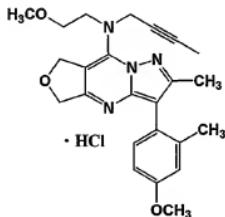
8-(N-シクロプロピルメチル-N-(2-ブチニル)アミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[3,4-d]ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.52 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.14 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81  
 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.37 (s, 2H), 5.05 (s, 2H), 4.58 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.62 (m,  
 2H), 2.35 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.84 (s, 3H), 1.20 (m, 1H), 0.63 (m, 2H), 0.36 (m,  
 5 2H)。

#### 実施例2 (271)

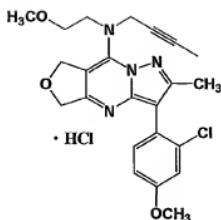
8-(N-(2-メトキシエチル)-N-(2-ブチニル)アミノ)-2-  
 メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-  
 10 フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.29 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.13 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.81  
 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 5.39 (s, 2H), 5.06 (s, 2H), 4.42 (s, 2H), 4.06 (m, 2H), 3.83 (s,  
 15 3H), 3.81 (m, 2H), 3.37 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.17 (s, 3H), 1.85 (s, 3H)。

#### 実施例2 (272)

8-(N-(2-メトキシエチル)-N-(2-ブチニル)アミノ)-2-  
 メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-  
 20 フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

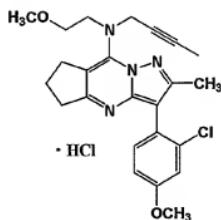


TLC : R<sub>f</sub> 0.39 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.28 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.37 (s, 2H), 4.92 (s, 2H), 4.36 (m, 2H), 3.95 (t, J = 5.4Hz, 5 H), 3.83 (s, 3H), 3.76 (t, J = 5.4Hz, 2H), 3.36 (s, 3H), 2.37 (s, 3H), 1.83 (s, 3H).

### 実施例2(273)

8-(N-(2-メトキシエチル)-N-(2-ブチニル)アミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-10,5H-シクロベンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



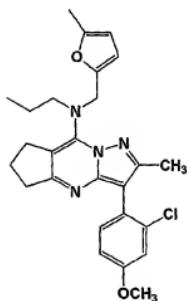
TLC : R<sub>f</sub> 0.44 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.93 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 4.53 (m, 2H), 4.18 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.81 (t, J = 4.8Hz, 15 H), 3.36 (s, 3H), 3.30 (m, 2H), 3.20 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.22 (quint, J =

7.2Hz, 2H), 1.86 (t, J = 2.4Hz, 3H),

#### 実施例2 (274)

- 8-(N-プロピル-N-(5-メチルフラン-2-イル)メチルアミノ)-  
 5-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

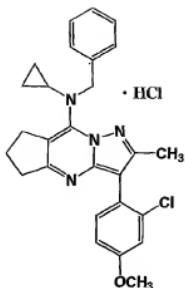


TLC : Rf 0.53 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

- NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89  
 10 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 5.99 (d, J = 3.0Hz, 1H), 5.85 (dd, J = 1.6, 3.0Hz, 1H), 4.78  
 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.35 (m, 2H), 2.90 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.81 (t, J = 7.2Hz, 2H),  
 2.39 (s, 3H), 2.22 (m, 3H), 2.07 (m, 2H), 1.62 (m, 2H), 0.91 (t, J = 7.5Hz, 3H).

#### 実施例2 (275)

- 15 8-(N-ベンジル-N-シクロプロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

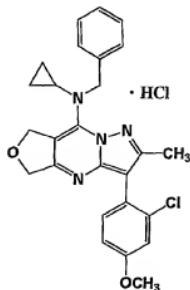


TLC : Rf 0.49 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.42 - 7.30 (m, 4H), 7.25 - 7.15 (m, 2H), 7.09 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.00 - 6.94 (m, 1H), 5.39 (d, J = 14.7Hz, 1H), 5.27 (d, J = 14.7Hz, 1H), 5 3.85 (s, 3H), 3.70 - 3.32 (m, 2H), 3.12 (m, 2H), 2.96 (m, 1H), 2.37 (s, 3H), 2.21 (m, 2H), 1.20 - 0.92 (m, 4H).

### 実施例2 (276)

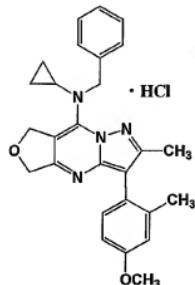
8-(N-ベンジル-N-シクロプロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドローフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩  
10



TLC : Rf 0.42 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.30 - 7.26 (m, 3H), 7.15 - 7.09 (m, 2H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 5.19 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.56 (m, 1H), 2.41 (s, 3H), 0.92 - 0.78 (m, 5 4H).

実施例2 (277)

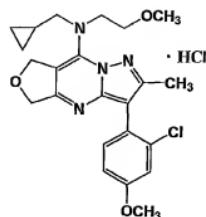
8-(N-ベンジル-N-シクロプロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] 10 ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.40 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.33 - 7.19 (m, 3H), 7.19 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.14 - 7.08 (m, 2H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.32 - 5.12 (m, 15 2H), 5.19 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.57 (m, 1H), 2.38 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 0.92 - 0.78 (m, 4H).

実施例2 (278)

8-(N-シクロプロピルメチル-N-(2-メトキシエチル)アミノ)-  
2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-  
ローフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



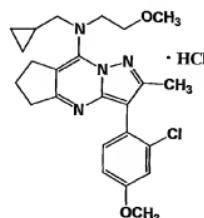
5 TLC : Rf 0.30 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.33 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.94 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.30 (m) and 5.27 (s) total 4H, 4.32 (m, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.72 - 3.67 (m, 4H), 3.31 (s, 3H), 2.36 (s, 3H), 1.11 (m, 1H), 0.71 (m, 2H), 0.36 (m, 2H)。

10

### 実施例2(279)

8-(N-シクロプロピルメチル-N-(2-メトキシエチル)アミノ)-  
2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-  
ロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

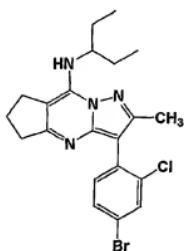


15

TLC : Rf 0.33 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.34 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.95  
 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.30 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.71 (d, J = 6.6Hz, 2H), 3.64 (t, J  
 = 5.1Hz, 2H), 3.41 (m, 2H), 3.29 (s, 3H), 3.07 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.24  
 5 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.09 (m, 1H), 0.65 (m, 2H), 0.31 (m, 2H).

実施例 2 (280)

8-(3-ベンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-プロモ  
 フェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,  
 10 5-a]ピリミジン

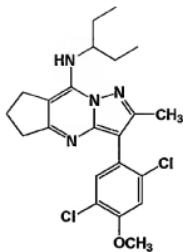


TLC : Rf 0.61 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.65 (d, J = 2.1Hz, 1H), 7.44 (dd, J = 2.1, 8.1Hz, 1H),  
 7.28 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.23 (br d, J = 10.5Hz, 1H), 3.81 (m, 1H), 3.09 (t, J = 7.2Hz,  
 15 2H), 2.90 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.15 (m, 2H), 1.60 - 1.82 (m, 4H), 1.01 (t,  
 J = 7.5Hz, 6H).

実施例 2 (281)

8-(3-ベンチルアミノ)-2-メチル-3-(2, 5-ジクロロ-4-  
 20 メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾ

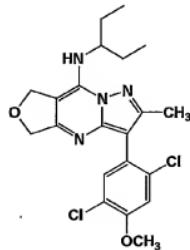
□ [1, 5-a] ピリミジン



TLC : R<sub>f</sub> 0.65 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.40 (s, 1H), 7.06 (s, 1H), 6.22 (br d, J = 10.5Hz, 1H),  
 5 3.92 (s, 3H), 3.81 (m, 1H), 3.08 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 1H), 2.33 (s,  
 3H), 2.15 (m, 2H), 1.58 - 1.82 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 6H).

### 実施例2 (282)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2, 5-ジクロロ-4-  
 10 メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-1H-フローフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1,  
 5-a] ピリミジン

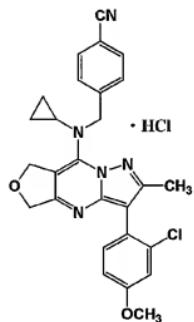


TLC : R<sub>f</sub> 0.61 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.39 (s, 1H), 7.07 (s, 1H), 6.34 (br d, J = 10.5Hz, 1H), 5.29 (m, 2H), 4.93 (m, 2H), 3.93 (s, 3H), 3.24 (m, 1H), 2.36 (s, 3H), 1.67 - 1.84 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

### 5 実施例2 (283)

8-(N-シクロプロピル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

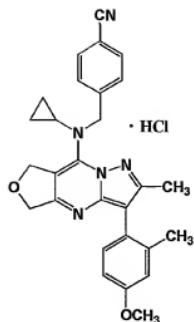


10 TLC : Rf 0.26 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.61 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.33 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.30 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.27 (s, 2H), 5.25 (s, 2H), 4.93 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.58 (m, 1H), 2.40 (s, 3H), 0.84 (m, 4H)。

### 15 実施例2 (284)

8-(N-シクロプロピル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

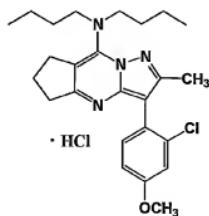


TLC : Rf 0.24 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.61 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.33 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.17  
 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.40 - 5.20  
 5 (m, 2H), 5.25 (s, 2H), 4.91 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 2.58 (m, 1H), 2.36 (s, 3H), 2.17 (s,  
 3H), 0.84 (m, 4H).

### 実施例2 (285)

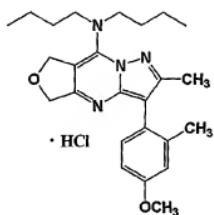
8-ジブチルアミノ-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.66 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.35 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.94  
 (dd, J = 8.4, 2.1Hz, 1H), 3.84 (s and m, total 7H), 3.35 (m, 2H), 3.01 (t, J = 7.5Hz,  
 2H), 2.33 (s, 3H), 2.22 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.67 (quint, J = 7.5Hz, 4H), 1.36 (sixt,  
 5 J = 7.5Hz, 2H), 0.95 (t, J = 7.5Hz, 6H).

### 実施例2 (286)

8-ジピチルアミノ-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-1-プロ [3,4-d] ピラゾロ [1,5-a] ピリ  
 10 ミジン・塩酸塩

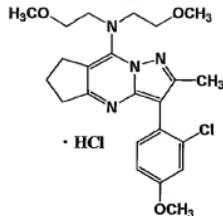


TLC : Rf 0.63 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.11 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.89 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.83  
 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.43 (s, 2H), 5.21 (s, 2H), 3.88 (m, 4H), 3.83 (s, 3H), 2.29 (s,  
 15 3H), 2.20 (s, 3H), 1.78 (quint, J = 7.5Hz, 4H), 1.42 (sixt, J = 7.5Hz, 4H), 1.00 (t, J =  
 7.5Hz, 6H).

### 実施例2 (287)

8-ビス(2-メトキシエチル)アミノ-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピ  
 20

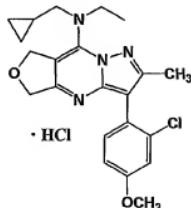
## ラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

TLC : R<sub>f</sub> 0.26 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.35 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.96  
 5 (dd, J = 9.0, 2.7Hz, 1H), 4.15 (m, 4H), 3.85 (s, 3H), 3.64 (t, J = 5.4Hz, 4H), 3.53 (m,  
 1H), 3.45 (m, 1H), 3.31 (s, 6H), 3.05 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.22 (quint, J =  
 7.2Hz, 2H)。

実施例2 (288)

10 8-(N-エチル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-1-プロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

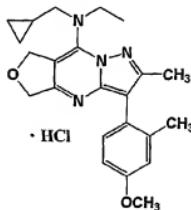
TLC : R<sub>f</sub> 0.49 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

15 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.31 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.92

(m, 1H), 5.28 (s, 2H), 5.11 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.81 (m, 2H), 3.69 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.33 (s, 3H), 1.09 (m, 1H), 0.60 (m, 2H), 0.24 (m, 2H).

### 実施例 2 (289)

- 5 8-(N-エチル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

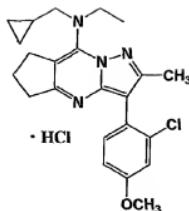


TLC : Rf 0.50 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

- 10 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.12 (m, 1H), 6.89 (s, 1H), 6.82 (m, 1H), 5.38 (m, 2H), 5.31 (m, 2H), 3.99 (m, 2H), 3.83 (s and m, total 5H), 2.31 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 1.44 (m, 3H), 1.19 (m, 1H), 0.72 (m, 2H), 0.36 (m, 2H).

### 実施例 2 (290)

- 15 8-(N-エチル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

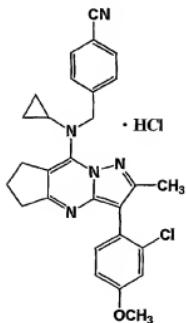


TLC : Rf 0.51 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.31 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.77 (q, J = 7.2Hz, 2H), 3.59 (d, J = 6.6Hz, 2H), 5 3.04 (t, J = 7.5Hz, 4H), 2.36 (s, 3H), 2.16 (q uint, J = 7.5Hz, 2H), 1.23 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.03 (m, 1H), 0.50 (m, 2H), 0.15 (m, 2H).

#### 実施例 2 (291)

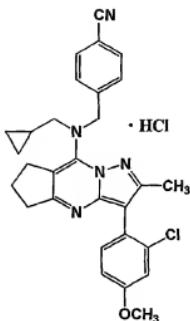
8 - (N - シクロプロピル - N - (4 - シアノフェニル) メチルアミノ) -  
10 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - メトキシフェニル) - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5 - a] ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.29 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) : δ 7.83 - 7.76 (m, 2H), 7.54 - 7.48 (m, 2H), 7.30 (dd, J = 8.7, 1.2Hz, 1H), 7.16 (m, 1H), 7.02 - 6.96 (m, 1H), 5.12 (m, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.06 (m, 2H), 2.94 - 2.78 (m, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.05 (m, 2H), 0.79 - 0.70 (m, 2H), 0.61 (m, 5 2H).

### 実施例 2 (2.9.2)

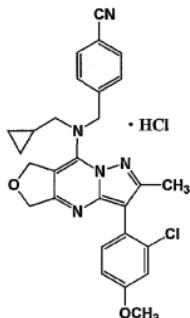
8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-10 ジヒドロ-5H-シクロベンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン・塩酸塩



TLC : Rf 0.37 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.69 (brd, J = 7.2Hz, 2H), 7.49 (brd, J = 7.2Hz, 2H), 15 7.34 (brd, J = 8.4Hz, 1H), 7.09 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.96 (m, 1H), 5.33 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.60 (m, 2H), 3.48 (m, 2H), 3.10 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.28 (m, 2H), 1.18 - 1.02 (m, 1H), 0.70 - 0.58 (m, 2H), 0.22 - 0.10 (m, 2H).

実施例2 (293)

8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドローフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

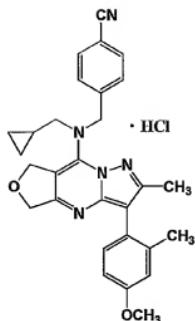


5

TLC : R<sub>f</sub> 0.21 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.68 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.52 (d, J = 8.1Hz, 2H), 7.31  
 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.94 (dd, J = 8.7, 2.4Hz, 1H), 5.26 (m,  
 4H), 5.14 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.45 (d, J = 6.6 Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 1.05 (m, 1H),  
 10 0.68 - 0.56 (m, 2H), 0.18 - 0.10 (m, 2H).

実施例2 (294)

8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-シアノフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドローフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩

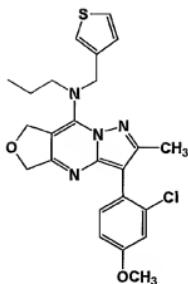


TLC : Rf 0.37 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.66 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.52 (d, J = 7.8Hz, 2H), 7.15  
 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.1, 2.4Hz, 1H), 5.25 (s,  
 5 2H), 5.13 (s, 2H), 5.00 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.41 (d, J = 6.6Hz, 2H), 2.34 (s, 3H),  
 2.18 (s, 3H), 1.02 (m, 1H), 0.60 - 0.52 (m, 2H), 0.12 - 0.06 (m, 2H).

### 実施例2 (295)

8-(N-プロピル-N-(チオフェン-3-イル)メチルアミノ)-2-  
 10 メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-  
 フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

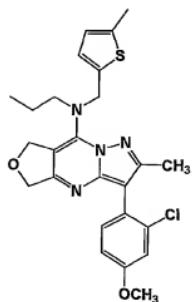


TLC : Rf 0.48 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.31 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.28 (m, 1H), 7.13 (m, 1H),  
7.08 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 0.9, 4.8Hz, 1H), 6.90 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H),  
5 5.08 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.32 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 1.64  
(m, 2H), 0.90 (t, J = 7.5Hz, 3H).

#### 実施例2 (296)

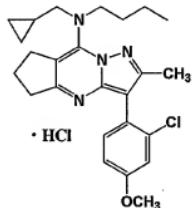
8 - (N-プロピル-N- (5-メチルチオフェン-2-イル) メチルアミノ) - 2-メチル-3- (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン  
10



TLC : Rf 0.50 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.31 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.90  
 (dd, J = 2.4, 8.7Hz, 1H), 6.66 (d, J = 3.3Hz, 1H), 5.56 (m, 1H), 5.02 - 5.17 (m, 4H),  
 4.90 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.27 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 1.64 (m, 2H),  
 5 0.92 (t, J = 7.5Hz, 3H).

実施例2 (297)

8 - (N-ブチル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-  
 (2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6-, 7-ジヒドロ-5H-シクロ  
 10 ペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

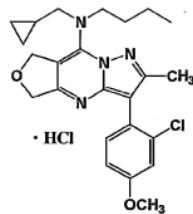


TLC : Rf 0.61 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.31 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.89  
 (dd, J = 8.7, 2.1Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.69 (t, J = 7.2Hz, 2H), 3.56 (d, J = 7.2Hz, 2H),  
 15 3.02 (m, 4H), 2.36 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.58 (quint, J = 7.5Hz, 2H),  
 1.34 (sixt, J = 7.5Hz, 2H), 1.02 (m, 1H), 0.91 (t, J = 7.5Hz, 3H), 0.48 (m, 2H), 0.13  
 (m, 2H).

実施例2 (298)

20 8 - (N-ブチル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-

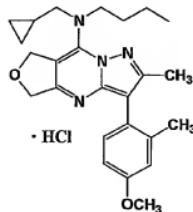
(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



- TLC : Rf 0.40 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 5 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.07 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.93 (dd, J = 8.4, 2.1Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 5.17 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.77 (m, 2H), 3.71 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.70 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.39 (sixt, J = 7.2Hz, 2H), 1.10 (m, 1H), 0.96 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.62 (m, 2H), 0.25 (m, 2H).

10 実施例2 (299)

8-(N-ブチル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



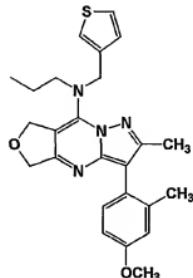
- 15 TLC : Rf 0.45 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.15 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.7, 2.1Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 5.13 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.75 (m, 2H), 3.70 (m, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.69 (m, 2H), 1.39 (sixt, J = 7.5Hz, 2H), 1.09 (m, 1H), 0.96 (t, J = 7.5Hz, 3H), 0.60 (m, 2H), 0.23 (m, 2H)。

5

実施例2 (3 0 0)

8-(N-プロピル-N-(チオフェン-3-イル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-1-フロ [3, 4-d] ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



10

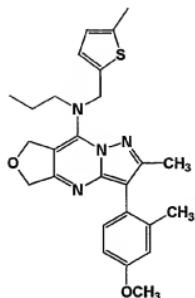
TLC : Rf 0.48 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.28 (dd, J = 2.7, 5.1Hz, 1H), 7.18 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.13 (m, 1H), 6.97 (dd, J = 1.5, 5.1Hz, 1H), 6.88 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 3.0, 8.7Hz, 1H), 5.07 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 4.87 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.31 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.64 (m, 2H), 0.91 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

実施例2 (3 0 1)

8-(N-プロピル-N-(5-メチルチオフェン-2-イル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-

ジヒドローフロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

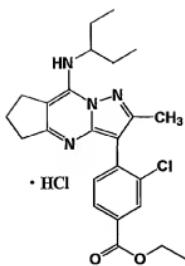


TLC : Rf 0.47 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 3.0Hz, 1H), 6.81  
5 (dd, J = 3.0, 8.4Hz, 1H), 6.65 (d, J = 3.3Hz, 1H), 6.55 (m, 1H), 5.11 (s, 4H), 4.88 (s,  
2H), 3.83 (s, 3H), 3.27 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.65 (m, 2H),  
0.92 (t, J = 7.5Hz, 3H).

### 実施例2 (3 0 2)

10 8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-エトキシカルボニルフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロヘpta [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩

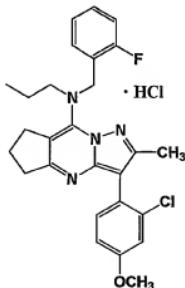


TLC : R f 0.56 (ヘキサン:酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.21 (d, J = 1.5Hz, 1H), 8.08 (dd, J = 1.5, 7.8Hz, 1H), 7.56 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.30 (brd, J = 10.8Hz, 1H), 4.38 (q, J = 6.9Hz, 2H), 4.00 (m, 1H), 3.34 - 3.64 (m, 2H), 3.15 (t, J = 6.9Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.31 (m, 2H), 1.65 - 1.96 (m, 4H), 1.41 (t, J = 6.9Hz, 3H), 1.07 (t, J = 7.5Hz, 3H), 1.06 (t, J = 7.5Hz, 3H)。

### 実施例 2 (303)

8-(N-プロピル-N-(2-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン・塩酸塩



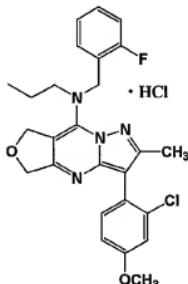
TLC : Rf 0.52 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.35 (m, 2H), 7.10 - 6.92 (m, 5H), 5.16 (m, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.70 (m, 2H), 3.60 - 3.34 (m, 2H), 3.03 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.26 (m, 2H), 1.75 (m, 2H), 0.94 (m, 3H).

5

実施例 2 (304)

8-(N-プロピル-N-(2-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



10

TLC : Rf 0.45 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

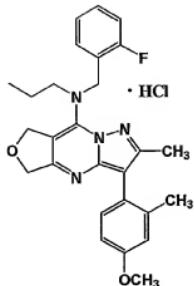
NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.48 - 7.33 (m, 2H), 7.13 - 7.04 (m, 4H), 6.97 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 5.50 - 5.15 (m, 4H), 5.17 (s, 2H), 3.85 (s, 3H), 3.74 - 3.60 (m, 2H), 2.37 (s, 3H), 1.82 (sext, J = 7.2Hz, 2H), 0.97 (t, J = 7.2Hz, 3H).

15

実施例 2 (305)

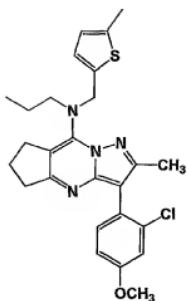
8-(N-プロピル-N-(2-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-

フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン・塩酸塩



- TLC : R<sub>f</sub> 0.55 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.36 - 7.26 (m, 1H), 7.16 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.09 -  
 5 6.96 (m, 3H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.82 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.13 (s, 2H),  
 5.03 (s, 2H), 5.02 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.41 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.19 (s, 3H), 1.69  
 (sext, J = 7.2Hz, 2H), 0.92 (t, J = 7.2Hz, 3H).

- 実施例2 (306)  
 10 8-(N-プロピル-N-(5-メチルチオフェニ-2-イル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン

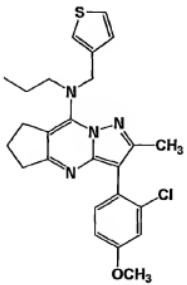


TLC: R<sub>f</sub> 0.57 (ヘキサン:酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 2.7, 8.4Hz, 1H), 6.64 (d, J = 3.3Hz, 1H), 6.54 (m, 1H), 4.96 (s, 2H), 3.84 (s, 5 3H), 3.38 (m, 2H), 2.90 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.86 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.08 (m, 2H), 1.61 (m, 2H), 0.90 (t, J = 7.5Hz, 3H).

## 実施例2（307）

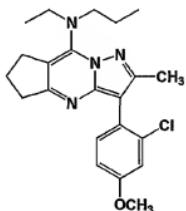
8-（N-プロピル-N-（チオフェン-3-イル）メチルアミノ）-2-  
10 メチル-3-（2-クロロ-4-メトキシフェニル）-6, 7-ジヒドロ-  
5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



TLC : Rf 0.53 (ヘキサン : �酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.25 (m, 1H), 7.11 (m, 1H),  
 7.07 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.95 (dd, J = 1.5, 5.1Hz, 1H), 6.89 (dd, J = 2.7, 8.7Hz, 1H),  
 4.85 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.39 (m, 2H), 2.90 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.81 (t, J = 7.2Hz,  
 5 2H), 2.39 (s, 3H), 2.07 (m, 2H), 1.60 (m, 2H), 0.89 (t, J = 7.2Hz, 3H).

実施例2 (308)

8 - (N-エチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ  
 -4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]  
 10 ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン

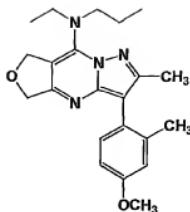


TLC : Rf 0.58 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.30 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.88  
 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.66 (q, J = 6.9Hz, 2H), 3.60 - 3.50 (m, 2H),  
 15 3.02 - 2.84 (m, 4H), 2.37 (s, 3H), 2.20 - 2.04 (m, 2H), 1.64 - 1.52 (m, 2H), 1.17 (t, J  
 = 6.9Hz, 3H), 0.90 (t, J = 6.9Hz, 3H).

実施例2 (309)

8 - (N-エチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル  
 20 -4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-フロ[3, 4-d]ピラゾ

ロ [1, 5-a] ピリミジン

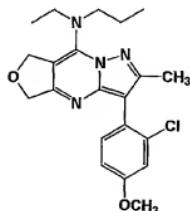


TLC : Rf 0.55 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.16 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.87 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.80  
 5 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.82 (s, 3H), 3.67 (q, J = 7.2Hz,  
 2H), 3.60 - 3.48 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.72 - 1.56 (m, 2H), 1.23 (t, J =  
 7.2Hz, 3H), 0.93 (t, J = 7.2Hz, 3H).

実施例2 (31.0)

10 8-(N-エチル-N-プロピルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ  
 -4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロフロ[3, 4-d]ピラン  
 ロ [1, 5-a] ピリミジン



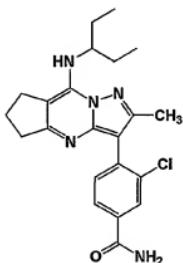
TLC : Rf 0.51 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

15 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.29 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.89

(dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 5.19 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.67 (q, J = 7.2Hz, 2H), 3.60 - 3.48 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.70 - 1.50 (m, 2H), 1.24 (t, J = 7.2Hz, 3H), 0.93 (t, J = 7.2Hz, 3H)。

5 実施例2 (3 1 1)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-カルバモイルフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロベンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



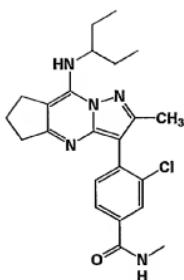
10 TLC : Rf 0.53 (塩化メチレン:酢酸エチル=10:1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.96 (d, J = 1.8Hz, 1H), 7.70 (dd, J = 8.1, 1.8Hz, 1H), 7.50 (d, J = 8.1Hz, 1H), 6.26 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.82 (m, 1H), 3.14 - 3.05 (m, 2H), 2.91 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.22 - 2.10 (m, 2H), 1.85 - 1.50 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.5Hz, 6H)。

15

実施例2 (3 1 2)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-(N-メチルカルバモイル)フェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロベンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

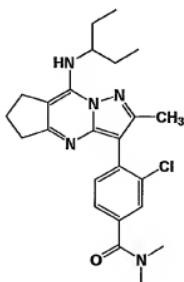


TLC : Rf 0.55 (塩化メチレン : 酢酸エチル = 10 : 1) ;

NMR (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :  $\delta$  7.89 (d,  $J = 1.8\text{Hz}$ , 1H), 7.64 (dd,  $J = 7.8, 1.8\text{Hz}$ , 1H),  
 7.45 (d,  $J = 7.8\text{Hz}$ , 1H), 6.42 (brs, 1H), 6.26 (d,  $J = 10.2\text{Hz}$ , 1H), 3.82 (m, 1H), 3.14 -  
 5 3.05 (m, 2H), 3.01 (d,  $J = 4.5\text{Hz}$ , 3H), 2.91 (t,  $J = 7.8\text{Hz}$ , 2H), 2.35 (s, 3H), 2.22 -  
 2.09 (m, 2H), 1.82 - 1.55 (m, 4H), 1.02 (t,  $J = 7.5\text{Hz}$ , 6H).

### 実施例2 (3-13)

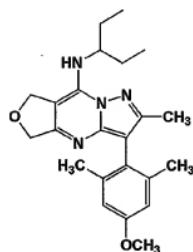
8-(3-ベンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-(N,  
 10 N-ジメチルカルバモイル)フェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロ  
 ペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



TLC : Rf 0.65 (塩化メチレン : 酢酸エチル = 10 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.56 (d, J = 1.5Hz, 1H), 7.46 (d, J = 7.8Hz, 1H), 7.36  
 (dd, J = 7.8, 1.5Hz, 1H), 6.26 (d, J = 9.9Hz, 1H), 3.82 (m, 1H), 3.17 - 3.02 (m, 8H),  
 2.92 (t, J = 7.8Hz, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.21 - 2.06 (m, 2H), 1.85 - 1.42 (m, 4H), 1.02 (t,  
 5 J = 7.5Hz, 6H).

#### 実施例2 (314)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2,6ジメチル-4-メトキシフェニル)-5,7ジヒドローフロ[3,4-d]ピラゾロ[1,10-5-a]ピリミジン

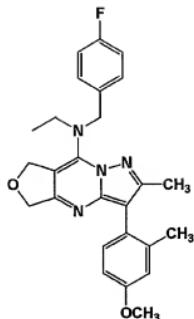


TLC : Rf 0.29 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 6.69 (s, 2H), 6.32 (d, J = 10.8Hz, 1H), 5.29 (s, 2H),  
 4.88 (s, 2H), 3.80 (s, 3H), 3.30 - 3.18 (m, 1H), 2.22 (s, 3H), 2.04 (s, 6H), 1.83 - 1.55  
 (m, 4H), 1.03 (t, J = 7.2Hz, 6H).

#### 実施例2 (315)

8-(N-エチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5,7ジヒドローフ

ロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

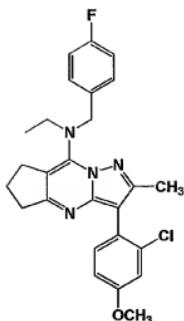


TLC : Rf 0.49 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.30 - 7.22 (m, 2H), 7.18 (d, J = 8.1Hz, 1H), 7.06 - 5 6.94 (m, 2H), 6.88 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 8.1, 2.7Hz, 1H), 5.09 (s, 2H), 4.96 - 4.80 (m, 4H), 3.83 (s, 3H), 3.41 (q, J = 7.2Hz, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.23 (t, J = 7.2Hz, 3H).

### 実施例2 (316)

- 10 8-(N-エチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン

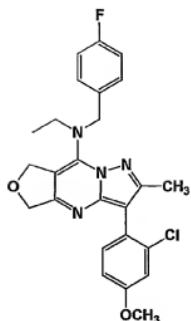


TLC : Rf 0.42 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.32 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.26 - 7.22 (m, 2H), 7.07 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.04 - 6.94 (m, 2H), 6.90 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 4.81 (s, 2H), 3.84 (s, 5 3H), 3.47 (q, J = 7.2Hz, 2H), 2.90 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.82 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.16 - 1.98 (m, 2H), 1.18 (t, J = 7.2Hz, 3H).

### 実施例2 (3-17)

8-(N-エチル-N-(4-フルオロフェニル)メチルアミノ)-2-メ  
10 テル-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-フ  
ロ[3, 4-d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン

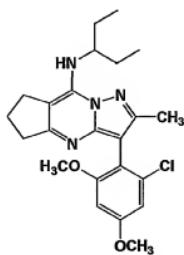


TLC : Rf 0.46 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) :  $\delta$  7.31 (d,  $J = 8.1\text{Hz}$ , 1H), 7.30 - 7.24 (m, 2H), 7.08 (d,  $J = 2.7\text{Hz}$ , 1H), 7.06 - 6.94 (m, 2H), 6.91 (dd,  $J = 8.1, 2.7\text{Hz}$ , 1H), 5.10 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 4.89 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.42 (q,  $J = 7.2\text{Hz}$ , 2H), 2.40 (s, 3H), 1.22 (t,  $J = 7.2\text{Hz}$ , 3H).

### 実施例2(318)

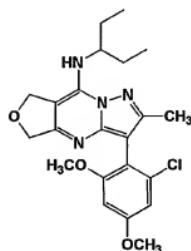
8-(3-ベンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4,6-ジメトキシフェニル)-6-ジメチルヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



TLC : Rf 0.26 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 6.67 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.45 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.23  
 (d, J = 10.8Hz, 1H), 3.82 (s, 3H), 3.80 (m, 1H), 3.70 (s, 3H), 3.07 (m, 2H), 2.90 (m,  
 2H), 2.25 (s, 3H), 2.13 (m, 2H), 1.52 - 1.80 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.2Hz, 3H), 1.01 (t,  
 5 J = 7.2Hz, 3H).

実施例 2 (3 1 9)

8 - (3 - ベンチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 4, 6 - ジ  
 メトキシフェニル) - 5, 7 - ジヒドロ - 1 - フロ [3, 4 - d] ピラゾロ [1,  
 10 5 - a] ピリミジン

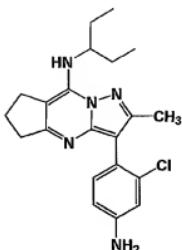


TLC : Rf 0.22 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;  
 NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 6.68 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.47 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.34  
 (d, J = 10.8Hz, 1H), 5.28 (s, 2H), 4.92 (d, J = 13.5Hz, 1H), 4.90 (d, J = 13.5Hz, 1H),  
 15 3.83 (s, 3H), 3.71 (s, 3H), 3.23 (m, 1H), 2.28 (s, 3H), 1.53 - 1.82 (m, 4H), 1.02 (t, J =  
 7.5Hz, 3H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 3H).

実施例 2 (3 2 0)

8 - (3 - ベンチルアミノ) - 2 - メチル - 3 - (2 - クロロ - 4 - アミノ

フェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ [d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

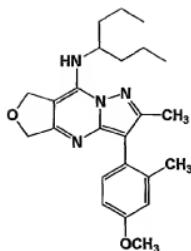


TLC : Rf 0.22 (ヘキサン:酢酸エチル=1:1) ;

5 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.16 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.82 (d, J = 2.1Hz, 1H), 6.63 (dd, J = 8.4, 2.1Hz, 1H), 6.21 (d, J = 10.2Hz, 1H), 3.87 - 3.62 (m, 3H), 3.12 - 3.03 (m, 2H), 2.95 - 2.86 (m, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.20 - 2.07 (m, 2H), 1.85 - 1.50 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.5Hz, 6H).

#### 10 實施例2 (3.2.1)

8-(4-ヘプチルアミノ)-2-メチル-3-(2-メチル-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-フロ [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン

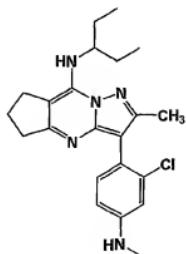


TLC : R<sub>f</sub> 0.48 (ヘキサン : �酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.15 (d, J = 8.7Hz, 1H), 6.86 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.79 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 6.32 (d, J = 10.8Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 4.90 (s, 2H), 3.82 (s, 5H), 3.40 (m, 1H), 2.32 (s, 3H), 2.18 (s, 3H), 1.78 - 1.38 (m, 8H), 0.95 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

### 実施例2 (3-2-2)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-クロロ-4-メチルアミノフェニル)-6-, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



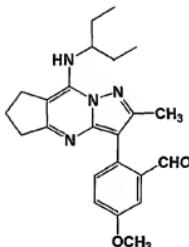
TLC : R<sub>f</sub> 0.45 (ヘキサン : �酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.18 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.73 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.56 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 6.21 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.88 - 3.70 (m, 2H), 3.12 - 3.02 (m, 2H), 2.95 - 2.80 (m, 2H), 2.85 (s, 3H), 2.34 (s, 3H), 2.20 - 2.05 (m, 2H), 1.80 - 1.50 (m, 4H), 1.01 (t, J = 7.2Hz, 6H).

5

実施例2 (3 2 3)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-ホルミル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



10

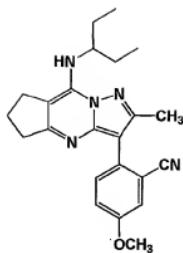
TLC : Rf 0.26 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 9.85 (s, 1H), 7.55 (d, J = 2.7Hz, 1H), 7.38 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.22 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 6.23 (d, J = 9.6Hz, 1H), 3.93 - 3.74 (m) and 3.89 (s) total 4H, 3.09 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.5Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 15 2.14 (quint, J = 7.5Hz, 2H), 1.83 - 1.50 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.5Hz, 6H).

実施例2 (3 2 4)

8-(3-ペンチルアミノ)-2-メチル-3-(2-シアノ-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,

5-a] ピリミジン

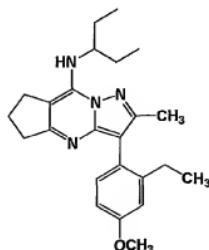


TLC : Rf 0.54 (ヘキサン : �酢酸エチル = 1 : 1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.46 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.24 (d, J = 2.4Hz, 1H), 7.18 (dd, J = 9.0, 2.4Hz, 1H), 6.24 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.88 - 3.73 (m) and 3.86 (s) total 4H, 3.09 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.92 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.15 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.80 - 1.50 (m, 4H), 1.02 (t, J = 7.2Hz, 6H).

実施例2 (325)

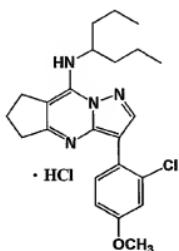
10 8-(3-ベンズチルアミノ)-2-メチル-3-(2-エチル-4-メトキシフェニル)-6,7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



TLC : R<sub>f</sub> 0.30 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 7.12 (d, J = 8.4Hz, 1H), 6.88 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.77  
 (dd, J = 8.4, 2.4Hz, 1H), 6.21 (d, J = 10.5Hz, 1H), 3.83 - 3.75 (m) and 3.83 (s) total  
 4H, 3.08 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.88 (t, J = 7.2Hz, 2H), 2.52 (q, J = 7.8Hz, 2H), 2.28 (s,  
 5 3H), 2.13 (quint, J = 7.2Hz, 2H), 1.83 - 1.50 (m, 4H), 1.10 - 0.98 (m, 9H).

実施例2 (326)

8 - (4-ヘプチルアミノ) - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル)  
 - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-a]ピ  
 10 リミジン・塩酸塩

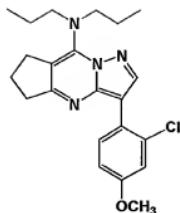


TLC : R<sub>f</sub> 0.51 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;  
 NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.20 (s, 1H), 7.65 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.38 (d, J =  
 10.2Hz, 1H), 7.08 - 6.97 (m, 2H), 4.15 (m, 1H), 3.84 (s, 3H), 3.61 (m, 2H), 3.16 (m,  
 15 2H), 2.33 (m, 2H), 1.88 - 1.60 (m, 4H), 1.60 - 1.35 (m, 4H), 0.99 (t, J = 7.5Hz, 6H).

実施例2 (327)

8 - (N, N-ジプロピルアミノ) - 3 - (2-クロロ-4-メトキシフェニル) - 6, 7-ジヒドロ-5H-シクロペンタ[d]ピラゾロ[1, 5-

## a] ピリミジン

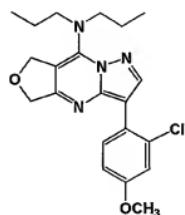


TLC : Rf 0.54 (ヘキサン : 酢酸エチル = 3 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.32 (s, 1H), 7.78 (d, J = 8.7Hz, 1H), 7.03 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 8.7, 2.7Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.57 (m, 4H), 2.97 (m, 4H), 2.17 (m, 2H), 1.66 - 1.50 (m, 4H), 0.88 (t, J = 7.5Hz, 6H).

実施例2 (328)

8-(N, N-ジプロピルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5, 7-ジヒドロ-1H-ピラゾロ[1, 5-a]ピリミジン



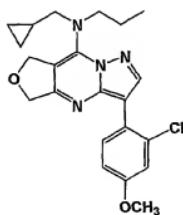
TLC : Rf 0.58 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.35 (s, 1H), 7.72 (d, J = 9.0Hz, 1H), 7.04 (d, J = 2.4Hz, 1H), 6.91 (dd, J = 9.0, 2.4Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 4.94 (s, 2H), 3.82 (s, 3H),

3.57 (t, J = 7.5Hz, 4H), 1.72 - 1.46 (m, 4H), 0.90 (t, J = 7.2Hz, 6H)。

実施例 2 (3 2 9)

8-(N-シクロプロピルメチル-N-プロピルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン

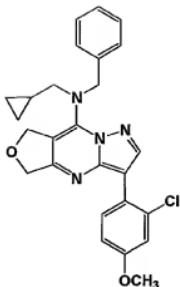


TLC : Rf 0.60 (ヘキサン:酢酸エチル=2:1) ;

NMR(300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.37 (s, 1H), 7.73 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.05 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.92 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 3.83 (s, 3H), 3.64 - 3.50 (m, 4H), 1.72 - 1.56 (m, 2H), 1.04 (m, 1H), 0.93 (t, J = 7.5Hz, 3H), 0.58 - 0.44 (m, 2H), 0.20 - 0.08 (m, 2H)。

実施例 2 (3 3 0)

15 8-(N-ペンジル-N-シクロプロピルメチルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-フロ[3,4-d]ピラゾロ[1,5-a]ピリミジン



TLC : Rf 0.52 (ヘキサン : 酢酸エチル = 2 : 1) ;

NMR (300MHz, CDCl<sub>3</sub>) : δ 8.42 (s, 1H), 7.74 (d, J = 8.4Hz, 1H), 7.38 - 7.20 (m, 5H), 7.06 (d, J = 2.7Hz, 1H), 6.93 (dd, J = 8.4, 2.7Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.96 (s, 2H), 5 4.95 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 3.43 (d, J = 6.6Hz, 2H), 1.04 (m, 1H), 0.58 - 0.46 (m, 2H), 0.16 - 0.04 (m, 2H).

### 実施例2 (3-1)

8-(N-シクロプロピルメチル-N-(4-メチルフェニル)メチルアミノ)-3-(2-クロロ-4-メトキシフェニル)-5,7-ジヒドロ-1-オクト [3, 4-d] ピラゾロ [1, 5-a] ピリミジン